Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/006004

International filing date: 23 March 2005 (23.03.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP

Number: 2004-084605

Filing date: 23 March 2004 (23.03.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 14 April 2005 (14.04.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in

compliance with Rule 17.1(a) or (b)



23.3.2005

日本国特許庁 JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日 Date of Application:

2004年 3月23日

出 願 番 号 Application Number:

特願2004-084605

[ST. 10/C]:

[JP2004-084605]

出 願 人
Applicant(s):

日産化学工業株式会社

特許庁長官 Commissioner, Japan Patent Office 2005年 2月 9日





1/E

【書類名】 特許願 【整理番号】 4670000 【提出日】 平成16年 3月23日 【あて先】 特許庁長官 殿 【国際特許分類】 C07D311/00 【発明者】 【住所又は居所】 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質 科学研究所内 生頼 一彦 【氏名】 【発明者】 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 【住所又は居所】 物質 科学研究所内 【氏名】 繁田 幸宏 【発明者】 千葉県船橋市坪井町722番地1 【住所又は居所】 日産化学工業株式会社 物質 科学研究所内 【氏名】 上杉 理 【発明者】 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質 【住所又は居所】 科学研究所内 【氏名】 岡田 匠 【発明者】 【住所又は居所】 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 【氏名】 松田 智行 【特許出願人】 【識別番号】 000003986 【氏名又は名称】 日産化学工業株式会社 藤本 修一郎 【代表者】 【電話番号】 047-465-1120 【手数料の表示】 【予納台帳番号】 005212 【納付金額】 21,000円 【提出物件の目録】

特許請求の範囲 1

明細書 1

要約書 1

【物件名】

【物件名】

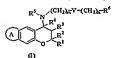
【物件名】

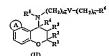
【書類名】特許請求の範囲

【請求項1】

式(I)又は(II)

【化1】





〔式中、 R^1 及び R^2 は、それぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基により任意に置換されていてもよい。)又は C_{6-1} 4 アリール基(該アリール基は、ハロゲン原子、水酸基、ニトロ基、シアノ基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基により任意に置換されていてもよい。)又は C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)により任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 R^3 は、水酸基若しくは C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基を意味するか、又は R^4 と一緒になって結合を意味し、

 R^4 は水素原子を意味するか、又は R^3 と一緒になって結合を意味し、

mは0~4の整数を意味し、

nは0~4の整数を意味し、

Vは単結合か、 $CR^7 R^8$ (R^7 は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 水酸基、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロ アリール基は何れも q 個の R^{1} 0 (R^{1} 0 はハロゲン原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基 (該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はC1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロ ゲン原子で任意に置換されていてもよい。)で任意に置換されていてもよい。)、Cı – 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニ トロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、 アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルカ ルボニルアミノ基、C₁ - 6 アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C₁ - 6 アルキルアミノカルボニル基、 ${\mathfrak SC}_1$ - 6 アルキルアミノカルボニル基、 ${\mathfrak C}_1$ - 6 アルキル カルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C₁₋₆アルキル スルホニル基、カルボキシル基又はC6-14アリールカルボニル基である。) により任 意に置換されていてもよく、gは1~3の整数を表し、gが2又は3の場合、R¹゚ は同 じでも異なっていてもよい。)、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シア ノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、C1 - 6 アルキルアミノ基、ジC1 - 6 ア ルキルアミノ基、C1 - 6 アルキルカルボニルアミノ基、C1 - 6 アルキルスルホニルアミ ノ基、アミノカルボニル基、C_{1 - 6} アルキルアミノカルボニル基、ジC_{1 - 6} アルキルア ミノカルボニル基、 C_1-6 アルキルカルボニル基、 C_1-6 アルコキシカルボニル基、ア ミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基又はスルホニル基で 任意に置換されていてもよい。)、 C_{6-14} アリール基、 C_{2-9} ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れもg個の R^{1} 0 $(R^{1}$ 0 及びgは、前記と同様の意 味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニトロ基、シアノ基 、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、アミノ基、C1-6 アルキルアミノ基、ジC1 - 6 アルキルアミノ基、C1 - 6 アルキルカルボニルアミノ基 、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカ ルボニル基、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C 1-6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、

カルボキシル基、 C_{6-1} 4 アリールカルボニル基又は C_{2-9} へテロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れも q 個の R^{1-0} (R^{1} 及び q は、前記と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 R^8 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、水酸基、 C_{1-6} 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C 6-14 アリール基、C2-9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は 何れも o 個の R^{1} 7 $(R^{1}$ 7 dR^{1} 0 と同様の意味を表し、 o は g と同様の意味を表す。) により任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ 基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、ジC 1-6 アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホ ニルアミノ基、アミノカルボニル基、C1 - 6 アルキルアミノカルボニル基、ジC1 - 6 ア ルキルアミノカルボニル基、 C_1-6 アルキルカルボニル基、 C_1-6 アルコキシカルボニ ル基、アミノスルホニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、カルボキシル基又はスルホ ニル基で任意に置換されていてもよい。)、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリー ル基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも o 個の R^{17} (R^{17} は R^{10} と同様の 意味を表し、oはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水 酸基、С1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていても よい。)、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、ス ルホニル基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 $\Im C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 C_{1-6} 6 アルキルカルボニルアミノ基、C₁₋₆ アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニ ル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 $5C_{1-6}$ アルキルアミノカルボニル基、 C_{1-6} 1-6 アルキルカルボニル基、 C_1-6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニ ル基は何れも o 個の R^{1} 7 $(R^{1}$ 7 は R^{1} 0 と同様の意味を表し、 o は g と同様の意味を表 す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味するか或いはR⁷及びR⁸が一緒に なって=0又は=Sを意味する。)、 NR^9 (R^9 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル 基は、ハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、水酸基、 $C_6 - 1$ 4 アリール基、 $C_2 - 9$ ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れも o 個の \mathbb{R}^{1} (\mathbb{R}^{1} は \mathbb{R}^{1} 0 と同様の意味を表 し、oはgと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C1-6ア ルキルアミノカルボニル基、ジ $C_1 - 6$ アルキルアミノカルボニル基、 $C_1 - 6$ アルキルカ ルボニル基、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆ アルキル アミノカルボニル基、ジC_{1 - 6} アルキルアミノカルボニル基、C_{1 - 6} アルキルカルボニ ル基、 $C_3 - 8$ シクロアルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、C₆₋₁₄アリールスルホニル基、C₂₋₉ヘテロアリールスルホ ニル基(該アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもo個のR¹⁷ $(R^{1-7} \, dR^{1-0} \, ele kon in kon in$ れていてもよい。)、カルボキシル基、 C_{6-14} アリールカルボニル基又は C_{2-9} ヘテ ロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何 れも o 個の \mathbb{R}^{1} (\mathbb{R}^{1} は \mathbb{R}^{1} は \mathbb{R}^{1} と同様の意味を表し、 o は g と同様の意味を表す。) に より任意に置換されていてもよい。)を意味する。)、O、S、SO又はSO2を意味し

 R^5 は、水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 R^6 は、水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アル

コキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基 、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C3-8シクロアルキル 基、C3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基は、ハロゲ ン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該 アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシ ル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、C1-6アルキルアミノ基、ジC1 - 6 アルキルアミノ基、C₆₋₁₄ アリールアミノ基、C₂₋₉ ヘテロアリールアミノ基 (該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れもp個のR¹8 (R¹8 はR¹0 と 同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール 基は何れもp個の $R^{1/8}$ ($R^{1/8}$ は $R^{1/0}$ と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す 。)により任意に置換されていてもよい。)又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシ クリル基は、ハロゲン原子、C1-6アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ア ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルコ キシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C6-14 アリール基、C2 - 9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個のR¹⁸ (R¹⁸ はR¹⁰ と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。) により任 意に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミ ド基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 $\Im C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 C_{1-6} アル キルカルボニルアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C 1-6 アルキルアミノカルボニル基、 $5C_1-6$ アルキルアミノカルボニル基、 C_1-6 ア ルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C₁₋₆ア ルキルスルホニル基、カルボキシル基又はC6-14アリールカルボニル基で任意に置換 されていてもよい。)を意味し、

Aはベンゼン環と縮合する 5 、 6 又は 7 員環(該 5 、 6 又は 7 員環は何れも 1 個の \mathbb{R}^{2} 1 $(R^{2}$ は R^{1} 0 と同様の意味を表し、1は $1\sim6$ の整数を意味し、1が $2\sim6$ の場合、R2 1 は同じでも異なっていてもよい。)により任意に置換されていてもよく、環の構成原 子として酸素原子、窒素原子又は硫黄原子を1~3原子単独もしくは組み合わせて含むこ とができ、環内の不飽和結合の数は、縮合するベンゼン環の不飽和結合を含め、1、2又 は3であり、環を構成する炭素原子は、カルボニル又はチオカルボニルであってもよい。)で表されるベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項2】

Aが、

(式中、 R^{11} 及び R^{12} はそれぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル 基は、ハロゲン原子、C1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、水酸基、C₆₋₁₄ アリール基、C₂₋₉ ヘテロアリール基(該 アリール基及びへテロアリール基は何れもr個の R^{19} (R^{19} は R^{10} と同様の意味を表 し、rはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} ア ルキルアミノカルボニル基、 $5C_1 - 6$ アルキルアミノカルボニル基、 $C_1 - 6$ アルキルカ ルボニル基、 $C_3 - 8$ シクロアルキルカルボニル基、 $C_1 - 6$ アルコキシカルボニル基、C1 - 6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6 - 1 4 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、C6-14 アリー ル基、 $C_{2} - 9$ ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもr 個の R^{1} ⁹ (R¹⁹ はR¹⁰ と同様の意味を表し、rはqと同様の意味を表す。) により任意に置換 されていてもよい。)、C1 - 6 アルキルアミノカルボニル基、ジC1 - 6 アルキルアミノ カルボニル基、 $C_1 - 6$ アルキルカルボニル基、 $C_3 - 8$ シクロアルキルカルボニル基、C1-6 アルコキシカルボニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、C6-1 4 アリールスル ホニル基、C2-9ヘテロアリールスルホニル基(該アリールスルホニル基及びヘテロア リールスルホニル基は何れもr個の R^{19} (R^{19} は R^{10} と同様の意味を表し、rはqと 同様の意味を表す。) により任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、C6-1 4 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基(該アリールカルボ ニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもr個の R^{19} (R^{19} は R^{10} と同様の意 味を表し、rはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)であり

 $R^{1\ 3}$, $R^{1\ 4}$, $R^{1\ 5}$ 及び $R^{1\ 6}$ はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 C_1 – 6 アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_1 – 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、水酸基、 C_6 – 1 4 アリール基、 C_2 – 9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$ ($R^{2\ 0}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表し、s は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、 C_1 – 6 アルキルアミノカルボニル基、 $3C_1$ – 6 アルキルアミノカルボニル基、 $3C_1$ – 6 アルキルカルボニル基、 $3C_1$ – 6 アルコキシカルボニル基、 $3C_1$ – 6 アルコキシルボニル基、カルボキシル基、 $3C_1$ – 6 アルコキシ基(該アルコキシ基は、ハロゲン原子、 $3C_1$ – 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、アミノ基、水酸基、 $3C_1$ – 6 アリール基又は $3C_2$ – 9 ヘテロアリール基(該

アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の R^{20} (R^{20} は R^{10} と同様の意味を表 し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により任意に 置換されていてもよい。)、C₁₋₆ チオアルコキシ基(該チオアルコキシ基は、ハロゲ ン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、カルボキシル基、水酸基、C6-14アリール基又はC2-9ヘテロアリール 基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもs個の R^{20} (R^{20} は R^{10} と同様の意 味を表し、sはgと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により 任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C₆₋₁₄アリール基、C₂₋₉ヘテロアリー ル基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$ ($R^{2\ 0}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の 意味を表し、sはgと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C 1-6アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基 、アミノ基、スルホニル基、C₁₋₆アルキルアミノ基、ジC₁₋₆アルキルアミノ基、C 6-14 アリールアミノ基、C2-9 ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及び ヘテロアリールアミノ基は何れも s 個の R^{2} 0 (R^{2} 0 は R^{1} 0 と同様の意味を表し、 s は qと同様の意味を表す。) により任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルキルカ ルボニルアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C₁₋₆ アルキルアミノカルボニル基、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、C₁₋₆アルキル カルボニル基、C₆₋₁₄アリールカルボニル基、C₂₋₉ヘテロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもs個の R^{2} 0 (R^{2} 0 は R¹⁰と同様の意味を表し、 s は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていて もよい。)、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C₁₋₆アルキルス ルホニル基、C6-14アリールスルホニル基、C2-9ヘテロアリールスルホニル基(該 アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもs個の R^{20} (R^{20} はR¹⁰と同様の意味を表し、 s は q と同様の意味を表す。) により任意に置換されていても よい。)、カルボキシル基、スルホニル基又はC2-9へテロシクリル基(該へテロシク リル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミ ノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルコキ シ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C₆ − 1 4 ア リール基、C2-9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもs個 に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド 基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 $\Im C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキ ルカルボニルアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C₁ - 6 アルキルアミノカルボニル基、ジC₁ - 6 アルキルアミノカルボニル基、C₁ - 6 アル キルカルボニル基、C₁ - 6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C₁ - 6 アル キルスルホニル基、カルボキシル基又はC6-14アリールカルボニル基で任意に置換さ れていてもよい。)であり、

XはO, S, SO又はSO2を意味する。) である請求項1記載のベンゾビラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

【請求項3】

 R^1 及び R^2 が共にメチルであり、 R^3 が水酸基であり、 R^4 が水素原子である請求項2記 載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項4】

 R^5 が水素原子であり、mが0~3の整数であり、nが0~2の整数である、請求項3記 載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項5】

Vが単結合である、請求項4記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項6】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{6-14} アリール基(該アリール基は

p個の $R^{1\ 8}$ ($R^{1\ 8}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表し、pは qと同様の意味を表す。) により 任意に置換されていてもよい。)である、請求項5記載のベンゾピラン誘導体又はその医 薬的に許容される塩。

【請求項7】

mが2である、請求項6記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項8】

R⁶ がC₆₋₁₄ アリール基(該アリール基は p 個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に 置換されていてもよく、pは1~3の整数を表し、pが2又は3の場合、置換基は同じで も異なっていてもよい。) である、請求項7記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に 許容される塩。

【請求項9】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_2-9 へテロアリール基(該ヘテロア リール基は何れも p 個の $R^{1\ 8}$ ($R^{1\ 8}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表し、 p は q と同様の意味 を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である、請求項5記載のベンゾピラン 誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項10】

mが2である、請求項9記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項11】

R⁶ が2-ピリジル、3-ピリジル又は4-ピリジルである請求項10記載のベンゾピラ ン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項12】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_2-4 アルキル基(該アルキル基はハ ロゲン原子、C1-6アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1-6アルコキシ基 (該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボ キシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルコキシ基(該アル コキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C3 - 8 シクロアルキル基、C3 - 8 シク ロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、C1-6 アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基は ハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基 で任意に置換されていてもよい。)、Cı - c アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン 原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に 置換されていてもよい。)又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基は、ハロ ゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキ シル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルコキシ基(該アルコ キシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、水酸基又はアミノ基で任意に 置換されていてもよい。)である請求項5記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許 容される塩。

【請求項13】

mが2である請求項12記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項14】

 \mathbb{R}^6 が \mathbf{n} -プロピル、 \mathbf{i} -プロピル、 \mathbf{c} -ペンチル、 \mathbf{c} -ペンチル、 $\mathbf{1}$ - \mathbf{c} -ペンテニル、 $\mathbf{2}$ - \mathbf{c} -ペンテ ニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル又は3-c-ヘキセニルである請求 項13記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項15】

Vが CR^7R^8 である請求項4記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

【請求項16】

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基 出証特2005-3008820

(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 $5C_{1-6}$ アルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 R^8 が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルコギン基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは R^7 及び R^8 が一緒になって=O又は=Sである請求項15記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項17】

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、 R^8 が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは R^7 及び R^8 が一緒になって=0である請求項 16 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項18】

 \mathbb{R}^7 が水酸基であり、 \mathbb{R}^8 が水素原子である請求項 \mathbb{R}^7 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項19】

 $mが1 \sim 2$ の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{6-1} 4 アリール基又は C_{2-9} ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個の R^{1-8} (R^{1-8} は R^{1-0} と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である請求項 1 5 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項20】

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 $5C_{1-6}$ アルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 R^8 が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは R^7 及び R^8 が一緒になって=0又は=S である請求項19記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項21】

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、 R^8 が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは R^7 及び R^8 が一緒になって=0である請求項20記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項22】

 ${\bf R}^7$ が水酸基であり、 ${\bf R}^8$ が水素原子である請求項 2 1 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項23】

mが1であり、nが0であり、 R^6 が C_{6-14} アリール基(該アリール基は何れもp個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に置換されていてもよく、pは $1\sim3$ の整数を表し、pが2又は3の場合、置換基は同じでも異なっていてもよい。)である請求項22記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項24】

mが $1\sim 2$ の整数であり、nが0であり、R 6 が C_{1-4} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。

)、 C_{3-8} シクロアルキル基、 C_{3-8} シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、F ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は C_{2-9} ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、F ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、F ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、F ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、F ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である請求項15記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項25】

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルキルアミノ基 、 C_{1-6} ジアルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 R^8 が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは R^7 及び R^8 が一緒になって=O又は=Sである請求項 2 4 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項26】

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、 R^8 が水素原子、又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは R^7 及び R^8 が一緒になって=0である請求項25記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項27】

 \mathbf{R}^7 が水酸基であり、 \mathbf{R}^8 が水素原子である請求項 $\mathbf{2}^6$ 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項28】

 R^6 がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ペンチル、1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、1-c-ペンチセニル、2-c-ペキセニル又は3-c-ペキセニルである請求項 2 7 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項29】

 R^7 及び R^8 が一緒になって=O又は=Sであり、 R^6 がアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{6-1} 4 アリールアミノ基、 C_{2-9} ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れも p 個の R^{1-8} (R^{1-6} と同様の意味を表し、p は Q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)又は C_{2-9} ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である請求項15記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項30】

Vが NR^9 である、請求項4記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項31】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{6-1} 4 アリール基又は C_{2-9} ヘテロ アリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp個の R^{18} (R^{18} は R^{10} と 同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である請求項30記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項32】

mが2である請求項31記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項33】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が水素原子、 C_2-4 アルキル基(該アルキ ル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていて もよい。)、C3 - 8 シクロアルキル基、C3 - 8 シクロアルケニル基(該シクロアルキル 基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基(該アルキル基はハロゲ ン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又はC2-9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、C1 - 6 アルキル基(該アル キル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に 置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されてい てもよい。)、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換され ていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい 。)である、請求項30記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項34】

mが2である請求項33記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項35】

式(I)である請求項3記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

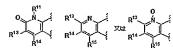
【請求項36】

式(II)である請求項3記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項37】

Aの環構造が

【化3】



(式中、 \mathbf{R}^{1} 、 \mathbf{R}^{1} 、 \mathbf{R}^{1} 及び \mathbf{R}^{1} は前記と同様の意味を表す。)である請求項 8、請求項11、請求項14、請求項23、請求項28又は請求項35記載のベンゾピラ ン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

【請求項38】

 R^{1} が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコ キシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又 は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、R¹³、R¹⁴及びR¹⁵がそれぞ れ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原 子、アミノ基、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換され ていてもよい。) 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 С3-8 シクロアルキ ル基(該シクロアルキル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハ ロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されて いてもよい。)、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、C₁ - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又 は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルキルカルボニル基、アミノカ

ルボニル基、アミノ基、カルボキシル基又はシアノ基である請求項37記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項39】

 R^{1-1} が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1-3} 、 R^{1-4} 及び R^{1-5} がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、アミノ基又はシアノ基である請求項 3 8 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

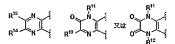
【請求項40】

 $R^{1\ 1}$ が水素原子であり、 $R^{1\ 3}$ が水素原子、ハロゲン原子、カルボキシル基又は $C_{1\ -6}$ アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1\ 4}$ が水素原子であり、 $R^{1\ 5}$ が水素原子、ハロゲン原子又は $C_{1\ -6}$ アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である請求項39記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項41】

Aの環構造が

【化4】



(式中、 R^{1} 1 、 R^{1} 2 、 R^{1} 3 及び R^{1} 4 は前記と同様の意味を表す。)である請求項 8 、請求項 1 1 、請求項 1 4 、請求項 2 3 、請求項 2 8 又は請求項 3 5 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

【請求項42】

 R^{1} 及び R^{1} 2 がそれぞれ独立して水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1} 3 及び R^{1} 4 がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、R1 5 次に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、R1 次のようとは、R1 次のようとは、R2 次のようとは、R3 次のようとは、R4 がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、R5 次のように置換されていてもよい。)、R6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、R5 次のように置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、R6 アルキルカルボニル基、アミノ基又はシアノ基である請求項41記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項43】

 R^{1} 及び R^{1} がそれぞれ独立して水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1} 3 及び R^{1} がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である請求項42記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項44】

 \mathbf{R}^{1} 1 \mathbf{R}^{1} 2 \mathbf{R}^{1} 3 及び \mathbf{R}^{1} 4 が共に水素原子である請求項 4 3 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項45】

Aの環構造が

【化5】

(式中、 R^{1} 、 R^{1} 及び R^{1} は前記と同様の意味を表す。)である請求項8、請求項11、請求項14、請求項23、請求項28又は請求項35記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

【請求項46】

【請求項47】

 R^{1-1} が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1-3} 及び R^{1-4} がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、XがOである請求項 4 6 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項48】

 $R^{1\ 1}$ が水素原子又は $C_{1\ -\ 6}$ アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1\ 3}$ 及び $R^{1\ 4}$ が共に水素原子であり、XがOである請求項47記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項49】

Aの環構造が

【化6】

(式中、 $R^{1\ 1}$ 、 $R^{1\ 2}$ 、 $R^{1\ 3}$ 及び $R^{1\ 4}$ は前記と同様の意味を表す。)である請求項 8、請求項 $1\ 1$ 、請求項 $1\ 4$ 、請求項 $2\ 3$ 、請求項 $2\ 8$ 又は請求項 $3\ 5$ 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

【請求項50】

 R^{1} 及び R^{1} 2 がそれぞれ独立して水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 C_{6-1} 4 アリール基(該アリール基はハロゲン原子、水酸基又はアルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)で任意に置換されていてもよい。)で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1} 3 及び R^{1} 4 がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルコキシ基はハロゲン原子、P 5 人基、P 6 アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、P 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、P 7 人基(以下ルコキシ基はハロゲン原子、P 7 人基(以下ルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基

で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である請求項49記載のベン ゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項51】

 R^{1} 及び R^{1} 2 がそれぞれ独立して水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1} 3 及び R^{1} 4 が共に水素原子である請求項 5 0 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項52】

2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g] キノリン-3-オール、2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエ チル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル、3-ヒドロキ シ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キ ノリン-7-カルボキサミド、{3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-「(2-フェニルエチル)ア [2, 3] [2, 3] [2, 3] [3, 4] [3, 4] [3, 4] [3, 4] [3, 4] [4]フェニルエチル) アミノ]-2.3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3.2-f]キノリン-2-オール、7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシー2, 2, 9-トリ メチルー4-[2-(フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2,3-g]キノリンー7-カルボン酸、<math>4-(ベンジルアミノ)-7クロロ-2,2,9-トリメチルー3、4-ジヒドロー2H-ピラノ「2、3-g] キノリンー3-オール、7-クロロ $-4-\{[2-(1,3-4)]$ トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロー2,2,9ートリメチルー4ー[(3-フェニルプロピル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(4-$ フルオロ フェニル)エチル]アミノ]ー2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2Hーピラノ[2 $r \in J - 2, 2, 9 - h$ リメチルー3, $4 - \mathcal{I} = [2, 3 - g]$ キノリ ートリメチルー3、4-ジヒドロー2H-ピラノ「2、3-g] キノリンー3-オール、4 $-\{[2-(4-r)]\}$ 4-3 + 2 + 2 + 3 + 4 + 3 + 4 + 4 + 5 + 5 + 6ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロー ル) アミノー2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2Hーピラノ[2,3ーg]キノ リン-3-オール、7-クロロ-4-1[2-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル) $x \neq v$] [2, 2, 9 - 1] [2, 3 - 1]g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4- $\{[2-(1-ピペリジ$ [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] $-\nu$ 、7-200-2 - 2 - 2 - 3 - 5 リメチルー4ー $\{[2-(1-x)]$ 0 - 2 - ピロリジニル)エチ $[\nu]$ アミノ $\{-3, 4-i$ ビドロ $\{-2, 4-i$ ピラノ[2, 3-g]キノリン $\{-3, 4-i$ 2 H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ $-4 - ({2 - [エチル(3 - メ$ (5,0) チルフェニル)アミノ(1,0) エチル(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0)H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4 $-\{[(1-x+v-(R)-2-v^2)+v^2]+v^2\}-3, 4-v^2+v^2+v^2\}$ ノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2, 2)]-ジエトキシエチル)アミノ]-3, 4ージヒドロー2Hーピラノ [2,3-g] キノリンー3 ーオール、7 ークロロー 2 . 2 . 9 ートリメチルー 4 ー {[2-(3-チエニル)エチル]アミノ}

-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、<math>7-クロロ-4-[2-(1-ピラゾリルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチルー3, 4ージヒドロー2 Hーピラノ [2, 3-g] キノリンー3 -オール、7 - クロロー4 - $\left[2-\left(4-\right)\right]$ メチルピラゾールー1ーイル)エチル]アミノー2,2,9ートリメチルー3,4ージヒ ドロー 2 H - - 2 H - $2 \text{$ ークロロピラゾールー1ーイル) エチル] アミノ}ー2,2,9ートリメチルー3, 4ージ ヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(2) —ピリジルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] $\pm J$ y = 3-x-y, y = 7-y y = 1 y =ミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン -3-オール、7-クロロ-4-[2-(4-ピリジルエチル) アミノ] $-\bar{2}$, 2, 9-ト リメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-ク , 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-イソブチルアミノ-2,2,9-トリ メチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7-クロ -2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-イソアミルアミノ -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、7-クロロー4-[2-(シクロペンチルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメ チルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、<math>7-クロロ-4-[2-(1-シクロペンテニルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4ージヒドロー 2 H ーピラノ [2, 3-g] キノリンー 3 - オール、7 - クロロー 2, 2, 9 -トリメチルー4-[(1,4-ジメチルペンチル)アミノ]-3,4-ジヒドロー<math>2H-ピラノ[[2,3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-(ペンチルアミノ) -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン<math>-3-オール、7-クロロ-4-[(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] -2,2,9ートリメチルー3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-2,2,9 -トリメチル-4-[(2-テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9ートリメチルー4- [(2-テトラヒドロ-2 H-チオピラン-4-イルエチル)アミノ] -3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 メチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、4-[(2 — ベンゾフラニルメチル) アミノ] -7-クロロ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジ ヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-ヒド , 3-g] キノリン-3-オール、7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミ ノ]-8,9-ジヒドロー7H-ピラノ[2,3-g]-キノキサリン-8-オール、 $\{[2-1]\}$ (2-7) (2ープルオフェニル) エチル]アミノ $\{-7, 7-5$ メチルー8, 9ージヒドロー7Hー $]r \ge J - 7$, $7 - \Im x \ne N - 8$, $9 - \Im L F - 7H - L = J - [2, 3 - g] - \pm J \pm H$ リン-8-オール、9-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-7,7-ジ メチルー8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー8-オール、7, 7-ジメチル 9-(ペンチルアミノ)-8,9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2,3-g]-キノキサリン-8-オール、2,3,7,7-テトラメチル 9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン<math>-8-オール、2,3,-ジエチルー $7,\ 7-$ ジメチル $9-[\ (2-$ フェニルエチル)アミノ $]-8,\ 9-$ ジヒ ドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、3, 7, 7ートリメチルー 2-フェニルー9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロー7Hーピラノ[2. 3-g] - キノキサリン-8-オール、2, 7, 7-トリメチル-3-フェニル-9サリン-8-オール、3,7,7-トリメチル-9-[(2-フェニルエチル)アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン<math>-8-オール、9-[(2-1)]シクロヘキシルエチル)アミノ]-7,7-ジメチル-8,9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g] -キノキサリン-8-オール、6, 7-イミダゾリノ-3, 4-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-4-(2 - 7) (2 - 7) (2 - 7) (2 - 7) (3 - 7) (4 - 7) (4 - 7) (5 - 7) (7 -ヒドロキシー6, 6-ジメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-4, 6, 7, 8ーテトラヒドロー1, 5ージオキサー4ーアザーアントラセンー3ーオン、7ーヒドロキシー 4, 6, 6-トリメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-4, 6, 7, 8-テトラヒド -フェニルエチルアミノ)-2, 3, 4, 6, 7, 8-ヘキサヒドロー1, 5-ジオキサ-4-アザーアントラセンー7ーオール、7ーヒドロキシー6,6ージメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-7,8-ジヒドロ-1H,6H-4,5-ジオキサ-1-アザ ーアントラセンー2ーオン、6,6-ジメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-2, 3, 7, 8-テトラヒドロー1H, 6H-4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー 7- オール、9- ヒドロキシメチル-2, 2- ジメチル-4- [(2- フェニルエチル) アミノ] -3, 4- ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3,7-ジオール、7-アミノメチル-2,2,9 - トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3 -オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-5-オキシ4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒ ドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチ ル] アミノ} -2, 2, 9-トリメチル-5-オキシ3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オー ル、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-5-オキシ4-(ペンチルアミノ)-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[[2,3-g] キノリン-[3-x] - [3-x] -チル-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール又は2,2-ジメ チル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オールであるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

【請求項53】

2, 2, 7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノ リン-3-オール、3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f] キノリン-2-オール、7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチ ル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメ チル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシー2, 2, 9-トリメチルー4-[2-(フェニルエチル)アミノ]-34-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボン酸、7-クロロ-4 ロー2Hーピラノ [2, 3-g] キノリンー3ーオール、 $7-クロロー4-\{[2-(2-フルオ$ ロフェニル)エチル]アミノ $\}-2,2,9-$ トリメチルー3,4-ジヒドロー2H-ピラノ $r \in J - 2, 2, 9 - h$ リメチルー3, $4 - \Im E \cap D = 2 + H - C \cap D = 1 + J \cap D = 1 +$ ン-3-オール、 $4-\{[2-(4-アミノフェニル)エチル]アミノ\}-7-クロロ-2,2,9$ ートリメチルー3,4ージヒドロー2 Hーピラノ[2, 3-g]キノリンー3ーオール、7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9ートリメチルー3. 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2,9-トリメチル-4-{[2-(1-ピペリジニル)エチル]アミノ}-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 - [2 - (4 -クロロ ピラゾールー1ーイル) エチル] アミノ}-2,2,9-トリメチルー3,4-ジヒドロー 2 H -ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- [2-(2-ピリジ ルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3g] キノリン-3-オール、7-クロロ<math>-4-[2-(3-3)] アミノ] ー 2, 2, 9 -トリメチル-3, 4 -ジヒドロ-2H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オ -ル、7-クロロ-4-[2-(4-ピリジルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル -3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4ーイソアミルアミノー2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2Hーピラノ[2,3g] キノリン-3 - オール、7 - クロロ-4 - [2 - (シクロペンチルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、7-クロロー4-[2-(1-シクロペンテニルエチル) アミノ] <math>-2,2,9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-クロロー2,2,9ートリメチルー4ー (ペンチルアミノ) -3, 4ージヒドロー2Hーピ ラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-シクロヘキシルエチ (ν) アミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 + - ピラノ [2, 3 - g] キ ノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシペンチル)アミノ]-2,2,9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7, 7-ジメチルー9-[(2-フェニルエチル)アミノ]-8,9-ジヒドロー7Hーピラノ[2, 3-g] - キノキサリン-8-オール、 $\{[2-(2-$ フルオフェニル) エチル] アミノ $\{ -7, 7-ジメチル8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー8-$ ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、9-[(2-ヒドロキ シー2-7ェニルエチル)アミノ]-7,7-ジメチル-8,9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g] - キノキサリン- 8 - オール、7 , 7 - ジメチル 9 - (ペンチルアミノ) -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、9-[(2-シクロヘキシルエチル)アミノ]ー7,7ージメチルー8,9ージヒドロー7Hーピラノ[2, 3-g] - キノキサリン-8-オール、7-ヒドロキシ-6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)ー4,6,7,8ーテトラヒドロー1,5ージオキサー4ーアザ ーアントラセンー3ーオン、7ーヒドロキシー4,6,6ートリメチルー8ー(2ーフェニ ルエチルアミノ)-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサ-4-アザーアン トラセン-3-オン、7-ヒドロキシ-6,6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミ ノ)-7,8-ジヒドロ-1H,6H-4,5-ジオキサ-1-アザーアントラセン-2 ーオン、9-ヒドロキシメチルー2,2-ジメチルー4-[(2-フェニルエチル)アミノ] -3, 4-ジヒドロ 2-H-ピラノ[2, 3-g]-キノリン-3-オール、2,2,9-トリメチ ル、7-アミノメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ $\}$ -2, 2, 9-トリメチル-5-オキシ3, 4-ジヒドロ-2H-ピラ ノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-(ペンチルアミノ) -3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチ ν]アミノ}-7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノ リン-3-オール又は2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラ ノ[2,3-g]キノリン-3-オールであるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩

【請求項54】

請求項 $1\sim53$ のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする医薬。

【請求項55】

請求項 $1\sim53$ のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする不整脈治療薬。

【書類名】明細書

【発明の名称】 3 環性ベンゾピラン化合物

【技術分野】

[0001]

本発明は、不応期延長作用を有するベンゾピラン誘導体に関するものであり、ヒトを含む哺乳動物に対する不整脈の治療に用いられるものである。

【背景技術】

[0002]

ベンゾピラン誘導体としてはクロマカリムに代表される4-アシルアミノベンゾピラン誘導体が知られている(例えば、特許文献1参照。)。これらクロマカリムに代表される4-アシルアミノベンゾピラン誘導体はATP感受性K*チャンネルを開口し、高血圧や喘息の治療に有効であることが知られているが、不応期延長作用に基づく不整脈の治療に関しては言及されていない。

[0003]

又、β3受容体作活性化作用を有し、肥満の治療に有効と考えられる4-アミノベンゾ ピラン誘導体が報告されている(例えば、特許文献2参照。)ものの、不応期延長作用に 基づく不整脈の治療に関しては言及されていない。

【特許文献1】特開昭58-67683号公報

【特許文献2】国際公開第2003/014113号パンフレット

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

[0004]

ところで、不応期延長作用を主たる機序とする従来の抗不整脈薬(例えばVaughanWilliamsによる抗不整脈薬分類の1群薬や、3群に属するdーソタロール、ドフェチライドなど)は、不応期延長作用と関連のある心室筋活動電位の延長に基づくtorsadesde pointes等の突然死を誘発しうる極めて危険な不整脈誘発作用が治療上の課題になっており、より副作用の少ない薬剤が望まれている。

【課題を解決するための手段】

[0005]

本発明者らはこの課題を解決するために、心室筋よりも心房筋に選択的な不応期延長作用を有する化合物の探索研究を実施した結果、一般式(I)又は(II)で表される化合物に、心室筋の不応期および活動電位に影響することなく心房筋に選択的な不応期延長作用があることを見出し、本発明を完成させた。

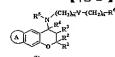
[0006]

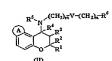
即ち、本発明は、

1. 式(I)又は(II)

[0007]

【化1】





[0008]

[式中、 R^1 及び R^2 は、それぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基により任意に置換されていてもよい。)又は C_{6-1} 4 アリール基(該アリール基は、ハロゲン原子、水酸基、ニトロ基、シアノ基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基により任意に置換されていてもよい。)又は C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)により任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 R^3 は、水酸基若しくは C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基を意味するか、又は R^4 と一緒になって結合を意味し、

 R^4 は水素原子を意味するか、又は R^3 と一緒になって結合を意味し、

mは0~4の整数を意味し、

nは0~4の整数を意味し、

Vは単結合か、 $CR^7 R^8 (R^7 は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、$ 水酸基、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロ アリール基は何れもq個の R^{10} (R^{10} はハロゲン原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はC1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロ ゲン原子で任意に置換されていてもよい。) で任意に置換されていてもよい。)、C1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニ トロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、 アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、ジ C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルカ ルボニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、ジ C_1 – $_6$ アルキルアミノカルボニル基、 C_1 – $_6$ アルキル カルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 C_{1-6} アルキル スルホニル基、カルボキシル基又はC6-14アリールカルボニル基である。) により任 意に置換されていてもよく、qは $1\sim3$ の整数を表し、qが2又は3の場合、 R^{1} 0は同 じでも異なっていてもよい。)、 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シア ノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、5 C_{1-6} ア ルキルアミノ基、C1-6アルキルカルボニルアミノ基、C1-6アルキルスルホニルアミ ノ基、アミノカルボニル基、C1 - 6 アルキルアミノカルボニル基、ジC1 - 6 アルキルア ミノカルボニル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、ア ミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基又はスルホニル基で 任意に置換されていてもよい。)、 C_{6-1} 4 アリール基、 C_{2-9} ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れもq個の R^{10} (R^{10} 及びqは、前記と同様の意 味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニトロ基、シアノ基 、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、アミノ基、C₁-6 アルキルアミノ基、ジC1 - 6 アルキルアミノ基、C1 - 6 アルキルカルボニルアミノ基 、C_{1 - 6} アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C_{1 - 6} アルキルアミノカ ルボニル基、 $\Im C_1$ - 6 アルキルアミノカルボニル基、 $\Im C_1$ - 6 アルキルカルボニル基、 $\Im C_1$ 1 - 6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルスルホニル基、 カルボキシル基、C6-14アリールカルボニル基又はC2-9ヘテロアリールカルボニル 基.(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもq個の $R^{1\ 0}$ (R^{1} ⁰及びqは、前記と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味

意味を表し、oはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水 酸基、С1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていても よい。)、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、ス ルホニル基、アミノ基、C1 - 6 アルキルアミノ基、ジC1 - 6 アルキルアミノ基、C1 - $_6$ アルキルカルボニルアミノ基、 C_{1} $_{-6}$ アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニ ル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 ${\it iC}_{1-6}$ アルキルアミノカルボニル基、C $_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $_{C_{1-6}}$ アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 $_{C}$ 1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基 (該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニ ル基は何れも o 個の \mathbb{R}^{1} 7 $(\mathbb{R}^{1}$ 7 は \mathbb{R}^{1} 0 と同様の意味を表し、 o は q と同様の意味を表 す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味するか或いはR⁷及びR⁸が一緒に なって=0又は=Sを意味する。)、 NR^9 (R^9 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル 基は、ハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、水酸基、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れもo個の R^{1} 7 $(R^{1}$ 7 tR^{1} 0 と同様の意味を表 し、oはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 ア ルキルアミノカルボニル基、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカ ルボニル基、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、C1-6アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、C₁ - 6 アルキル アミノカルボニル基、 $\Im C_1$ - 6 アルキルアミノカルボニル基、 C_1 - 6 アルキルカルボニ ル基、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{6-1} 4 アリールスルホニル基、 C_{2-9} ヘテロアリールスルホ ニル基(該アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもo個の R^{1} 7 $(R^{1})^7$ は R^{1} と同様の意味を表し、o は q と同様の意味を表す。)により任意に置換さ れていてもよい。)、カルボキシル基、 C_{6-14} アリールカルボニル基又は C_{2-9} ヘテ ロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何 れも o 個の \mathbb{R}^{1} 7 $(\mathbb{R}^{1}$ 7 \mathbb{tR}^{1} 0 と同様の意味を表し、 o は q と同様の意味を表す。)に より任意に置換されていてもよい。)を意味する。)、〇、S、SO又はS〇2を意味し

 R^5 は、水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 R^6 は、水素原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アル コキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基 、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C3 - 8シクロアルキル 基、C3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基は、ハロゲ ン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該 アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシ ル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、 C_1 - 6 アルキルアミノ基、 $\Im C_1$ - 6 アルキルアミノ基、C6 - 1 4 アリールアミノ基、C2 - 9 ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れもp個の $R^{1\ 8}$ ($R^{1\ 8}$ は $R^{1\ 0}$ と 同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C₆₋₁₄アリール基、C₂₋₉ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール 基は何れもp個の $R^{1\ 8}$ ($R^{1\ 8}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す 。) により任意に置換されていてもよい。) 又はC2 - 9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシ クリル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ア ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 C_{6-1} 4 アリール基、 C_{2-9} ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも p 個の R^{1-8} (R^{1-8} は R^{1-0} と同様の意味を表し、P は Q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、カルボキシル基又は C_{6-1} 4 アリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)を意味し、

【0009】 2. Aが、 【0010】 【化2】

されていてもよい。)、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、ジ C_{1-6} アルキルアミノ

 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 及び R^{16} はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - 6 アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ 基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、水酸基、C6 − 1 4 ア リール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもs個 $\mathcal{O}R^{2\ 0}$ $(R^{2\ 0}\ tR^{1\ 0}\$ と同様の意味を表し、sはqと同様の意味を表す。)により任意 に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、ジ C_{1-6} アルキル アミノカルボニル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₃₋₈シクロアルキルカルボニル 基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、カルボキシル基、 C6-14アリールカルボニル基又はC2-9ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換さ れていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、カル ボキシル基、アミノ基、水酸基、C6-14アリール基又はC2-9ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$ ($R^{2\ 0}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表 し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により任意に 置換されていてもよい。)、 C_{1-6} チオアルコキシ基(該チオアルコキシ基は、ハロゲ ン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、カルボキシル基、水酸基、C6-14アリール基又はC2-9ヘテロアリール 基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもs個の R^{20} (R^{20} は R^{10} と同様の意 味を表し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により 任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリー ル基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$ ($R^{2\ 0}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の 意味を表し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C 1-6 アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基 、アミノ基、スルホニル基、 $C_{1\,\,-\,\,6}$ アルキルアミノ基、ジ $C_{1\,\,-\,\,6}$ アルキルアミノ基、C6-14 アリールアミノ基、C2-9 ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及び ヘテロアリールアミノ基は何れも s 個の R^{2} 0 (R^{2} 0 は R^{1} 0 と同様の意味を表し、 s は qと同様の意味を表す。) により任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルキルカ ルボニルアミノ基、C_{1 - 6} アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C_{1 - 6} アルキルアミノカルボニル基、ジC1-6アルキルアミノカルボニル基、C1-6アルキル カルボニル基、C6-14アリールカルボニル基、C2-9ヘテロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもs個の $R^{2\ 0}$ ($R^{2\ 0}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表し、sは q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていて もよい。)、C1 - 6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルス ルホニル基、C6-14アリールスルホニル基、C2-9ヘテロアリールスルホニル基(該 アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもs個の R^{2} 0 (R^{2} 0 はR10 と同様の意味を表し、 s は q と同様の意味を表す。) により任意に置換されていても よい。)、カルボキシル基、スルホニル基又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシク リル基は、ハロゲン原子、C1-6アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミ ノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルコキ シ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C6 − 1 4 ア

リール基、 C_{2-9} ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の R^{2-0} (R^{2-0} は R^{1-0} と同様の意味を表し、s は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 S_{1-6} アルキルアミノ基、 S_{1-6} アルキルアミノ基、 S_{1-6} アルキルスルボニルアミノ基、 S_{1-6} アルキルスルボニル基、 S_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 S_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 S_{1-6} アルキルカルボニル基、 S_{1-6} アルコキシカルボニル基、 S_{1-6} アルキルスルホニル基、 S_{1-6} アルキルスルホニル基、 S_{1-6} アルキルスルホニル基、 S_{1-6} アルキルスルホニル基、 S_{1-6} アルキルスルホニル基、 S_{1-6} アルキルスルホニル基、 S_{1-6} アルカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)であり、

[0012]

3. R^1 及び R^2 が共にメチルであり、 R^3 が水酸基であり、 R^4 が水素原子である 2. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0013]

4. R^5 が水素原子であり、mが $0 \sim 3$ の整数であり、nが $0 \sim 2$ の整数である、3 . 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0014]

5. Vが単結合である、4. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される 塩。

[0015]

6. $mが1\sim3$ の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{6-14} アリール基(該アリール基はp 個の R^{18} (R^{18} は R^{10} と同様の意味を表し、p はQ と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である、S. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0016]

7. mが2である、6. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0017]

8. R^6 が C_{6-14} アリール基(該アリール基は p 個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に置換されていてもよく、p は $1\sim3$ の整数を表し、p が 2 又は 3 の場合、置換基は同じでも異なっていてもよい。)である、7. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0018]

9. $mが1\sim3$ の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{2-9} へテロアリール基(該ヘテロアリール基は何れもp個の R^{1-8} (R^{1-8} は R^{1-0} と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である、5. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0019]

10. mが2である、9. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0020]

11. R^6 が 2-ピリジル、3-ピリジル又は 4-ピリジルである 10. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0021]

12. mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{2-4} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{3-8} シクロアルキル基、 C_{3-8} シクロアルキル

3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子 、C1-6アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1-6アルコキシ基(該アルコ キシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又 は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基は ハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基 で任意に置換されていてもよい。) 又はC2 - 9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基 は、ハロゲン原子、C1-6アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1-6アルコ キシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、 カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、水酸基又はアミノ基 で任意に置換されていてもよい。)である5. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的 に許容される塩。

[0022]

13. mが2である12. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0023]

1 4. R^6 がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ヘキシル、1-c-ペンテニル、 2-c-ペンテニル、<math>3-c-ペンテニル、<math>1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル又は3-c-ヘキセニル である13. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0024]

VがCR⁷R⁸である4.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容さ れる塩。

[0025]

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} ア ルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ 基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルコキシ 基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルキ ルアミノ基、ジC₁₋₆アルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、R⁸が水素原子又 は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。) であるか或いは R 7 及び R 8 が一緒になって= O又は=Sである15. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0026]

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又 はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、R⁸が 水素原子又はC₁₋₆アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシ ル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いはR⁷及びR⁸が一緒になって=O である16. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0027]

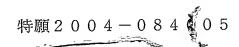
18. R⁷ が水酸基であり、R⁸ が水素原子である 17. 記載のベンゾピラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

[0028]

19. mが1~2の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{6-14} アリール基又は C_{2} -9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個の $R^{1/8}$ ($R^{1/8}$ はR¹⁰と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されてい てもよい。)である15. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0029]

20. R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} ア ルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ 基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C₁ - 6 アルコキシ



基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルキ ルアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 R^{8} が水素原子又 は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。) であるか或いは R 7 及び R 8 が一緒になって= O又は=Sである19. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0030]

 R^{7} が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又 21. はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。) 又はカルボキシル基であり、 R^8 が 水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシ ル基で任意に置換されていてもよい。) であるか或いは \mathbb{R}^7 及び \mathbb{R}^8 が一緒になって $=\mathbb{O}$ である20. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0031]

22. R 7 が水酸基であり、 R^8 が水素原子である21.記載のベンゾピラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

[0032]

23. mが1であり、nが0であり、R⁶がC₆₋₁₄アリール基(該アリール基は何 れもp個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に置換されていてもよく、pは1~3の整数 を表し、pが2又は3の場合、置換基は同じでも異なっていてもよい。)である22. 記 載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0033]

mが1~2の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{1-4} アルキル基(該アルキ ル基は、ハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に 置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されてい てもよい。)、C3-8シクロアルキル基、C3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキ ル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基(該アルキル基はハロ ゲン原子、C1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されてい てもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。) 、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい 。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又はC2 - g ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、C1 - 6 アルキル基(該ア ルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意 に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されて いてもよい。) C₁₋₆ アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換され ていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい 。) である15. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0034]

25. R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} ア ルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ 基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆アルコキシ 基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆アルキ ルアミノ基、 C_{1-6} ジアルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 R^8 が水素原子又 はC1-6アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、C1-6アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いはR⁷ 及びR⁸ が一緒になって= O又は=Sである24. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0035]

 R^7 が水酸基、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又 はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。) 又はカルボキシル基であり、 R^8 が 水素原子、又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基、カルボキシ

ル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは R^7 及び R^8 が一緒になって= Oである 25.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0036]

2.7. R^7 が水酸基であり、 R^8 が水素原子である 2.6. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0037]

28. R^6 がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ヘキシル、1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル又は3-c-ヘキセニルである 27. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0038]

29. R^7 及び R^8 が一緒になって=O又は=Sであり、 R^6 がアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、ジ C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基(該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れも p 個の R^{1-8} (R^{1-8} は R^{1-0} と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)又は C_{2-9} ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 R^{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 R^{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 R^{1-6} アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 R^{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 R^{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 R^{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 R^{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)である R^{1-6} 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0039]

30. Vが NR^9 である、4. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0040]

3 1. mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が $C_6~1$ 4 アリール基又は $C_2~-9$ ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個の $R^{1~8}$ ($R^{1~0}$ と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である 3 0. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0041]

32. mが2である31. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0042]

33. $mが1\sim3$ の整数であり、nが0であり、 R^6 が水素原子、 C_2-4 アルキル基(該アルコキシ基はハロゲン原子、 C_1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_3-8 シクロアルキル基、 C_3-8 シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、 C_1-6 アルコキシ基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は C_2-9 へテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 C_1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である、30. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0043]

34. mが2である33. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0044]

式(I)である3.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0045]

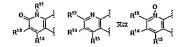
36. 式(II)である3.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される 塩。

[0046]

37. Aの環構造が

[0047]

【化3】



[0048]

【0040】 (式中、 R^{11} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は前記と同様の意味を表す。)である8.、 11. 、14. 、23. 、28. 又は35. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的 に許容される塩。

[0049]

38. R^{1} が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1} - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1\ 3}$ 、 $R^{1\ 4}$ 及び R^{1} ⁵ がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆ アルキル基(該アルキル基は ハロゲン原子、アミノ基、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意 に置換されていてもよい。) 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。) 、C3-8シ クロアルキル基(該シクロアルキル基はハロゲン原子、C1-6アルコキシ基(該アルコ キシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に 置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、ア ミノ基、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。) 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルキルカルボニル 基、アミノカルボニル基、アミノ基、カルボキシル基又はシアノ基である37. 記載のべ ンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0050]

39. R¹¹ が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、ア ミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1/3}$ 、 $R^{1/4}$ 及び $R^{1/5}$ がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基(該アルキル基はハロ ゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、ア ミノ基又はシアノ基である38. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される 塩。

[0051]

40. R^{11} が水素原子であり、 R^{13} が水素原子、ハロゲン原子、カルボキシル基 又はC1-6アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置 換されていてもよい。) であり、 $R^{1/4}$ が水素原子であり、 $R^{1/5}$ が水素原子、ハロゲン 原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意 に置換されていてもよい。) である39. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許 容される塩。

[0052]

41. Aの環構造が

[0053]

ル基で任意に置換されていてもよい。) であるか或いは R⁷ 及び R⁸ が一緒になって = O である25.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0036]

27. R^7 が水酸基であり、 R^8 が水素原子である 26. 記載のベンゾピラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

[0037]

 R^6 がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ヘキシル、1-c-ペンテニル、 2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル又は3-c-ヘキセニル である27.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0038]

29. R^7 及び R^8 が一緒になって=O又は=Sであり、 R^6 がアミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、ジC₁₋₆アルキルアミノ基、C₆₋₁₄アリールアミノ基、C₂₋₉ ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れも p 個 の $R^{1\ 8}$ ($R^{1\ 8}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表し、pは q と同様の意味を表す。)により任意 に置換されていてもよい。)又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロ ゲン原子、C1 - 6 アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該 アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシ ル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)である15.記載のベンゾピラン誘導体又はそ の医薬的に許容される塩。

[0039]

30. VがNR⁹である、4. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され る塩。

[0040]

31. mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が C_{6-14} アリール基又は C_{2} - 9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも p 個のR¹⁸ (R¹⁸ はR¹⁰と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されてい てもよい。)である30.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

 $[0\ 0\ 4\ 1\]$

32. mが2である31. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0042]

33. mが1~3の整数であり、nが0であり、 R^6 が水素原子、 C_2-4 アルキル基 (該アルキル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子 で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換 されていてもよい。)、C₃₋₈シクロアルキル基、C₃₋₈シクロアルケニル基(該シク ロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基(該アルキル 基はハロゲン原子、C1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換 されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていても よい。)、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されてい てもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。) 又はC2-9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、C1-6 アルキル基 (該アルキル基はハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子 で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換 されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に 置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されてい てもよい。) である、30. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0043]

mが2である33. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩 3 4.

[0044]

 $\bar{\mathbf{3}}$ 5. 式 (I) である $\mathbf{3}$. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0045]

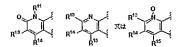
36. 式 (II) である3. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0046]

37. Aの環構造が

[0047]

【化3】



[0048]

(式中、 R^{1} 1 、 R^{1} 3 、 R^{1} 4 及び R^{1} 5 は前記と同様の意味を表す。)である 8. 、 1 1. 、 1 4. 、 2 3. 、 2 8. 又は 3 5. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0049]

38. $R^{\frac{1}{2}}$ が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{\frac{1}{3}}$ 、 $R^{\frac{1}{4}}$ 及び $R^{\frac{1}{5}}$ がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{3-8} シクロアルキル基(該シクロアルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、アミノカルボニル基、アミノ基、カルボキシル基又はシアノ基である37. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0050]

39. $R^{\frac{1}{2}}$ が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{\frac{1}{3}}$ 、 $R^{\frac{1}{4}}$ 及び $R^{\frac{1}{5}}$ がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、アミノ基又はシアノ基である38. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0051]

40. R^{1} が水素原子であり、 R^{1} が水素原子、ハロゲン原子、カルボキシル基又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1} が水素原子であり、 R^{1} が水素原子、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である39. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0052]

4 1. Aの環構造が

[0053]

【化4】

[0054]

(式中、 R^{1} 、 R^{1} 、 R^{1} 及び R^{1} は前記と同様の意味を表す。)である 8. 、 11 、 14 、 23 、 28 . 又は 35 . 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0055]

42. R^{1-1} 及び R^{1-2} がそれぞれ独立して水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1-3} 及び R^{1-4} がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 R^{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 R_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 R_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、 R_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 R_{1-6} アルキルカルボニル基、 R_{1-6} アノ基である41. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0056]

43. R^{1} 及び R^{1} 2 がそれぞれ独立して水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1} 3 及び R^{1} 4 がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である 42. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0057]

44. R^{1} 、 R^{1} 、 R^{1} 、 R^{1} 及び R^{1} が共に水素原子である 43 . 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0058]

45. Aの環構造が

[0059]

【化5】

[0060]

(式中、 R^{1} 、 R^{1} 及び R^{1} は前記と同様の意味を表す。)である 8. 、 1 1. 、 1 4. 、 2 3. 、 2 8. 又は 3 5. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0061]

46. $R^{1\ 1}$ が水素原子又は $C_{1\ -6}$ アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1\ -6}$ アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1\ 3}$ 及び $R^{1\ 4}$ がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1\ -6}$ アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1\ -6}$ アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1\ -6}$ アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1\ -6}$ アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基であり、XがO, S, S, S, O又はS, O2 である A5. 記載

のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0062]

47. R^{1-1} が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1-3} 及び R^{1-4} がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、Xが〇である 46. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0063]

48. R^{1} が水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1} 及び R^{1} が共に水素原子であり、XがOである 47. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0064]

49. Aの環構造が

[0065]

【化6】

[0066]

(式中、 R^{1} 、 R^{1} 、 R^{1} な 及び R^{1} は前記と同様の意味を表す。)である 8. 、 1 1. 、 1 4. 、 2 3. 、 2 8. 又は 3 5. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0067]

50. R^{1-1} 及び R^{1-2} がそれぞれ独立して水素原子又は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 C_{6-1} 4 アリール基(該アリール基はハロゲン原子、水酸基又はアルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 R^{1-3} 及び R^{1-4} がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基はハロゲン原子、アミノ基、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 C_{1-6} アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である49. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0068]

51. R¹ 及びR¹ がそれぞれ独立して水素原子又はC₁ - 6 アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、R¹ 及びR¹ が共に水素原子である 50. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0069]

 ヒドロキシメチル-2.2.9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシー2, 2, 9-トリメチルー4-[2- (フェニルエチル) アミノ]-3, 4 -ジヒドロ-2 H -ピラノ[2, 3 - g]キノリン - 7-カルボン酸、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジ ヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、4-(ベンジルアミノ)-7クロロー2,2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、 $7-クロロ-4-\{[2-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル) メチル] アミノ}ー$ 2, 2, 9 -トリメチルー3, 4 -ジヒドロー2 H -ピラノ[2, 3 - g] キノリンー3 -オ -ル、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(3-フェニルプロピル)アミノ]-3,4-フルオロフェニル)エチル]アミノ-2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(2-)$ ルオロフェニ ル)エチル]アミノ $\{-2,2,9-$ トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2,3g] キノリンー3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(4-$ クロロフェニル)エチル]アミノ -2,2,9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2 Hーピラノ [2,3-g] キノリンー3-オール、 $4-\{[2-(4-アミノフェニル)エチル]アミノ\}-7-クロロー2,2,9ートリメ$ チルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g] キノリンー3ーオール、<math>7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 - クロロ-4 - (2-フ ェニルブチル) アミノー 2 , 2 , 9 - トリメチルー 3 , 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(1, 3-ベンゾジオキソール$ -5-4ル) エチル] アミノ-2, 2, 9 -トリメチル-3, 4 -ジヒドロ-2 H-ピラ ノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-{[2-(1)]-ピペリジニル)エチル]アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリ ン-3 - オール、 7 - クロロ- 2 , 2 , 9 - トリメチル-4 - $\{[2-(1-メチル-2-ピロリ$ ジニル)エチル]アミノ $\}-3$, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、4-[(2-rリニノエチル)rミノ]-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H -ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4-($\{2$ -[エチル(3-メチルフェニル)アミノ]エチル $\}$ アミノ) -2,2,9ートリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-ト リメチル $-4-\{[(1-エチル-(R)-2-ピロリジニル)メチル]アミノ\}-3,4-ジヒドロ$ -2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチ $\nu - 4 - [(2, 2- i x +$ g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4- $\{[2$ -(3-チエニル) エチル]アミノ $\}-3$, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール 、 7 ークロロー 4 ー [2 ー (1 ーピラゾリルエチル) アミノ] ー 2 , 2 , 9 ートリメチルー 3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(4-x)] + [2-(4-x)] + [2-$ 3. 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(2-3)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-(2-2)] [2-H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- [2-(3-ピリジル エチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g]] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(4-ピリジルエチル)アミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン- 3 - オー ル、7-クロロー4-エチルアミノー2,2,9-トリメチルー3,4-ジヒドロー2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-イソブチルアミノ-2,2,9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、 7-クロロ-4-[(シクロプロピルメチル)アミノ]-2,2,9ートリメチルー3,4-

ジヒドロー2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロー4-イソアミ ルアミノー 2 , 2 , 9 ートリメチルー 3 , 4 ージヒドロー 2 H ーピラノ [2 , 3 ー g] キノリ ン-3-オール、7-クロロ-4- [2-(シクロペンチルエチル) アミノ] -2,2,9 ートリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-クロロー4ー [2-(1-シクロペンテニルエチル) アミノ]-2,2,9ートリメチル -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリンー3ーオール、<math>7-クロロ-2, 2, 9 - トリメチルー 4 - [(1, 4-ジメチルペンチル)アミノ] - 3, 4 - ジヒドロー 2 H -ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-2ロロ-2,2,9-トリメチル-4-(ペンチルアミノ) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール、7-クロロー4-[(2-シクロヘキシルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、<math>7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4- [(2-テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルエチル) アミノ 2, 2, 9 -トリメチル-4 - [(2-テトラヒドロ-2H-チオピラン-4-イルエチル)]アミノ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g] キノリン-3-オール、<math>7-ク9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、 4-[(2-ベンゾフラニルメチル) アミノ] -7-クロロー2,2,9-トリメチルー3. 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロー4-[(2-ヒドロキシペンチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピ ラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7,7-ジメチル<math>-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オールロー7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、 $\{[2-(4-7) + 7] + 7\}$ ル) エチル] $r \in \mathcal{J}$ - 7, 7 - ジメチル - 8, 9 - ジヒドロ - 7 H - ピラノ[2, 3 - g] ーキノキサリン-8-オール、9-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]ー 7, 7 - ジメチル-8, 9 - ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、7,7-ジメチル 9ー(ペンチルアミノ)-8,9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2 , 3-g]-キノキサリン-8-オール、2, 3, 7, 7-テトラメチル 9-[(2-フェ ニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8ーオール、2,3, -ジエチル-7, 7-ジメチル 9-[(2-フェニルエチル)アミノ]ー 8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、3, 7, 7-トリメチルー2-フェニルー9-[(2-フェニルエチル)アミノ]-8,9-ジヒドロー 7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、2, 7, 7-トリメチル-3-フ ェニルー 9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3]ル) $r \ge J - 8$, $9 - \Im E F D - 7H - ピラノ[2, 3 - g] - キノキサリン <math>- 8 - \pi D$ 、9-[(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] -7, 7-ジメチル-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、6,7-イミダゾリノー3,4-ジ ヒドロ-2, 2-ジメチル-4-(2 '-フェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピランー 3-オール、7-ヒドロキシー6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-4,6, 7, 8-テトラヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー3-オン、7 -ヒドロキシー4, 6, 6-トリメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-4, 6, 7, 8-テトラヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー3-オン、6, 6-ジ メチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-2, 3, 4, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1, 5-ジオキサー4ーアザーアントラセンー7ーオール、7ーヒドロキシー6,6ージメチ $\nu-8-(2-フェニルエチルアミノ)-7$, 8-ジヒドロ-1H, 6H-4, 5-ジオキサ(3, 7, 8-r)=1 H, (6H-4, 5-r)=1ントラセンー7ーオール、9-ヒドロキシメチル-2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)ア

ミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3,7-ジオール、7-アミノメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-2,2,9-トリメチル-5-オキシ3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-(ペンチルアミノ)-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール又は2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オールであるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0070]

2, 2, 7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2 ,3-g]キノリン-3-オール、3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1 H-ピラノ[3,2-f]キノリン-2-オール、7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(4-$ フルオロフェニル)エチル]アミノ $\}-2$, 2, 9-ト リメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-ク $\Box\Box-4-\{[2-(2-フルオロフェニル)エチル]アミノ\}-2,2,9-トリメチル-3,4$ ージヒドロー $2 \, \mathrm{H}$ - ℓ = ℓ =ークロロフェニル)エチル]アミノ}−2,2,9−トリメチル−3, 4−ジヒドロ−2H− ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチルー4-[2-(フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー7-カルボン酸、4-{[2-(4-アミノフェニル)エチル]アミノ}-7-クロロー 2, 2, 9 ートリメチルー3, 4 ージヒドロー2 Hーピラノ [2, 3-g] キノリンー3 ーオ -ル、7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9ートリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-クロ ロー2,2,9ートリメチルー4ー $\{[2-(1-ピペリジニル)エチル]アミノ\}-3,4-ジヒ$ ドロー 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 - オール、7 - クロロー 4 - 1 [2 - (4ークロロピラゾールー1ーイル) エチル] アミノ - 2,2,9 - トリメチルー3,4 ージ ヒドロー $2 \, \mathrm{H}$ - $2 \, \mathrm{H}$ - - $2 \, \mathrm{H}$ - $2 \, \mathrm{H}$ - $2 \, \mathrm{H}$ - $2 \, \mathrm{H}$ - - $2 \, \mathrm{H}$ --ピリジルエチル) アミノ] -2, 2, 9 -トリメチル- 3, 4 -ジヒドロ- 2 H -ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(3-ピリジルエチル) ア ミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン -3-オール、7-クロロ-4- [2-(4-ピリジルエチル) アミノ] -2, 2, 9-ト リメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-ク ロロー4-イソアミルアミノー2,2,9-トリメチルー3,4-ジヒドロー2H-ピラノ アミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリ ン-3 - 3,2,9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オー ル、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-(ペンチルアミノ)-3,4-ジヒドロー2 H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 - [(2 - シクロへキ)]シルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3] -g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシペンチル) アミノ]-2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン- 3 - オー ル、7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, <math>9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、 $\{[2-(2-)$ ルオフェニル)エチ ν]アミノ} -7, 7-ジメチル8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサ

リン-8-オール、 $\{[2-(4-$ フルオフェニル) エチル] アミノ $\}$ - 7. 7 - ジメチル -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、<math>9-[(2, 3-g)]ーヒドロキシー2ーフェニルエチル)アミノ]-7,7ージメチルー8,9ージヒドロー 7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー8-オール、7, 7-ジメチル 9-(ペンチ ルアミノ) -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、9-[(2-シクロヘキシルエチル)アミノ]-7,7-ジメチル-8,9-ジヒドロー 7H-ピラノ[2.3-g]ーキノキサリン-8ーオール、7-ヒドロキシー6,6ージメチ -4-7 + -7 2-フェニルエチルアミノ)-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサー4-ア ザーアントラセンー3ーオン、7ーヒドロキシー6,6ージメチルー8ー(2ーフェニルエ チルアミノ)-7、8-ジヒドロ-1H、6H-4、5-ジオキサ-1-アザーアントラ セン-2-オン、9-ヒドロキシメチル-2, 2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ2-H-ピラノ[2, 3-g]-キノリン-3-オール、2,2,9-トリメチル-4-「(2-フェニルエチル)アミノ]-3.4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2.3-g]キノリン-3. 7-ジオール、7-アミノメチル-2, 2, 9-トリメチル-4- [(2-フェニルエチル) アミノ] -3, 4-ジ ヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロ ロ-4- {[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-2,2,9-トリメチル-5-オキシ3,4-ジヒド u-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-(ペン チルアミノ)-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、4-1[2-(4-7)]カーフ ェニル)エチル]アミノ}-7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g]キノリン-3-オール又は2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒド ロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オールであるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許 容される塩。

[0071]

54. $1. \sim 53.$ のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする医薬。

[0072]

55. 1. \sim 53. のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする不整脈治療薬。 に関するものである。

[0073]

本発明化合物は、強い不応期延長作用を有し、不整脈治療薬として用いることができる

【発明を実施するための最良の形態】

[0074]

次に、本発明化合物(I)又は(II)の各置換基を具体的に説明する。

[0075]

なお、本明細書中「n」はノルマルを、「i」はイソを、「s」はセカンダリーを、「t」はターシャリーを、「c」はシクロを、「o」はオルトを、「m」はメタを、「p」はパラを意味し、「Ph」はフェニルを、「Py」はピリジルを、「Bn」はベンジルを、「Me」はメチルを、「Et」はエチルを、「Pr」はプロピルを、「Bu」はブチルを、「Pen」はペンチルを、「Hex」はヘキシルを意味する。

[0076]

 C_{2-4} アルキル基としては、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル及びt-ブチル等が挙げられる。

[0077]

 C_{1-4} アルキル基としては、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル及びt-ブチル等が挙げられる。

[0078]

[0079]

好ましくは、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、n-ペンチル及びi-ペンチルが挙げられる。

[0080]

 C_{3-8} シクロアルキル基としては、c-プロピル、c-ブチル、1-メチル-c-プロピル、2-メチル-c-プロピル、2-メチル-2-プロピル、2-ペンチル、1-メチル-2-プロピル、2-メチル-2-プロピル、2-ペンチル、2- メチル-2-プロピル、2- スチル-2-プロピル、2- スチル-2-プロピル、2- スチル-2-プロピル、2- スチル-2- スチル 2- スチル-2- スチル 2- ステル 2

[0081]

好ましくは c-ペンチル及びc-ヘキシルが挙げられる。

 C_{3-8} シクロアルケニル基としては、1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-メチル-2-c-ペンテニル、1-メチル-3-c-ペンテニル、2-メチル-1-c-ペンテニル、2-メチル-2-c-ペンテニル、2-メチル-3-c-ペンテニル、2-メチル-4-c-ペンテニル、2-メチル-5-c-ペンテニル、2-メチレン-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-メチル-1-c-ペンテニル、3-スチール-1-c-ペンテニル、3-スチール、3-スチール、3-ステール、3

[0082]

好ましくは1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル及び3-c-ヘキセニルが挙げられる。

[0083]

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる 。好ましくは、フッ素原子、塩素原子及び臭素原子が挙げられる。

[0084]

 C_{1-6} アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、t-ブトキシ、t-アトキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペンチルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシルオキシ、t-ペキシーの-プトキシ等が挙げられる。

[0085]

好ましくは、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ及びi-プロポキシが挙げられる。

[0086]

 C_{1-6} チオアルコキシ基としては、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プ

ロピルチオ、c-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、t-ベンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ等が挙げられる。

[0087]

 C_1 - 6 アルキルカルボニルオキシ基としては、メチルカルボニルオキシ、エチルカルボニルオキシ、n-プロピルカルボニルオキシ、i-プロピルカルボニルオキシ、n-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、ネオペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、ネオペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-メチル-i-ペンチルカルボニルオキシ、i-メチル-i-ペンチルカルボニルオキシ及びi-ジメチル-i-ブチルカルボニルオキシ等が挙げられる。

[0088]

好ましくは、メチルカルボニルオキシ、エチルカルボニルオキシ、n-プロピルカルボニルオキシ、i-プロピルカルボニルオキシ、n-ブチルカルボニルオキシ及びt-ブチルカルボニルオキシが挙げられる。

[0089]

 C_{6-14} アリール基としては、フェニル、o-ビフェニリル、m-ビフェニリル、p-ビフェニリル、 α -ナフチル、 β -ナフチル、1-アントリル、2-アントリル、9-アントリル、1-フェナントリル、2-フェナントリル、3-フェナントリル、4-フェナントリル及び9-フェナントリル等が挙げられる。

[0090]

好ましくは、フェニル、ο-ビフェニリル、m-ビフェニリル、ρ-ビフェニリル、α-ナフチル及びβ-ナフチルが挙げられる。

[0091]

 C_{2-9} ヘテロアリール基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$ 員環までの C_{2-6} 単環式複素環基及び構成原子数が $8\sim1$ 0までの C_{5-9} 縮合二環式複素環基が含まれる。

[0092]

 $5 \sim 7$ 員環までの C_{2-6} 単環式複素環基としては、2-4 エニル基、3-4 エニル基、2-7 リル基、3-7 リル基、2-1 リル基、3-1 リリショニル基、3-1 リリショニル国、3-1 リリショニュース 3-1 リリショニュース 3

[0093]

構成原子数が $8\sim1$ 0までの C_{5-9} 縮合二環式複素環基としては、2-ベンゾフラニル基、3-ベンゾフラニル基、4-ベンゾフラニル基、5-ベンゾフラニル基、6-ベンゾフラニル基、7-ベンゾフラニル基、1-イソベンゾフラニル基、4-イソベンゾフラニル基、1-インベンゾチエニル基、1-ベンゾチエニル基、1-ベンゾチエニル基、1-インベンゾチエニル基、1-インベンゾチエニル基、1-インベンゾチエニル基、1-インベンゾチエニル基

、2-クロメニル基、3-クロメニル基、4-クロメニル基、5-クロメニル基、6-ク ロメニル基、7-クロメニル基、8-クロメニル基、1-インドリジニル基、2-インド リジニル基、3-インドリジニル基、5-インドリジニル基、6-インドリジニル基、7 -インドリジニル基、8-インドリジニル基、1-イソインドリル基、2-イソインドリ ル基、4-イソインドリル基、5-イソインドリル基、1-インドリル基、2-インドリ ル基、3-インドリル基、4-インドリル基、5-インドリル基、6-インドリル基、7 ーインドリル基、1ーインダゾリル基、2ーインダゾリル基、3ーインダゾリル基、4ー インダゾリル基、5-インダゾリル基、6-インダゾリル基、7-インダゾリル基、1-プリニル基、2-プリニル基、3-プリニル基、6-プリニル基、7-プリニル基、8-プリニル基、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノリル基、6-キノリル基、7ーキノリル基、8ーキノリル基、1ーイソキノリル基、3ーイソキノリル 基、4-イソキノリル基、5-イソキノリル基、6-イソキノリル基、7-イソキノリル 基、8-イソキノリル基、1-フタラジニル基、5-フタラジニル基、6-フタラジニル 基、1-2、7-ナフチリジニル基、3-2,7-ナフチリジニル基、4-2,7-ナフチ リジニル基、1-2,6-ナフチリジニル基、3-2,6-ナフチリジニル基、4-2,6ーナフチリジニル基、2-1,8-ナフチリジニル基、3-1,8-ナフチリジニル基、4 -1,8-ナフチリジニル基、2-1,7-ナフチリジニル基、3-1,7-ナフチリジニ ル基、4-1,7-ナフチリジニル基、5-1,7-ナフチリジニル基、6-1,7-ナフ チリジニル基、8-1,7-ナフチリジニル基、2-1,6-ナフチリジニル基、3-1, 6-ナフチリジニル基、4-1,6-ナフチリジニル基、5-1,6-ナフチリジニル基、 7-1,6-ナフチリジニル基、8-1,6-ナフチリジニル基、2-1,5-ナフチリジ ニル基、3-1,5-ナフチリジニル基、4-1,5-ナフチリジニル基、6-1,5-ナ フチリジニル基、7-1,5-ナフチリジニル基、8-1,5-ナフチリジニル基、2-キ ノキサリニル基、5-キノキサリニル基、6-キノキサリニル基、2-キナゾリニル基、 4-キナゾリニル基、5-キナゾリニル基、6-キナゾリニル基、7-キナゾリニル基、 8-キナゾリニル基、3-シンノリニル基、4-シンノリニル基、5-シンノリニル基、 6-シンノリニル基、7-シンノリニル基、8-シンノリニル基、2-プテリジニル基、 4-プテリジニル基、6-プテリジニル基及び7-プテリジニル基等が挙げられる。

[0094]

好ましくは、2-ピリジル基、3-ピリジル及び基4-ピリジル基が挙げられる。

[0095]

 C_{2-9} ヘテロシクリル基としては、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子の中から自由に選ばれる1つ以上の原子と2つ乃至9つの炭素原子からなる単環及び縮環二環性の複素環基が挙げられ、具体的には、

[0096]

【化7】

等が挙げられる。

[0098]

 C_{1-6} アルキルアミノ基としては、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ、c-プロピルアミノ、n-ブチルアミノ、i-ブチルアミノ、c-ブチルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ベンチルア

ミノ、1-ヘキシルアミノ、2-ヘキシルアミノ、3-ヘキシルアミノ、c-ヘキシルアミノ、1-メチル-n-ペンチルアミノ、1,1,2-トリメチル-n-プロピルアミノ、1,2,2-トリメチル-n-プロピルアミノ及び3,3-ジメチル-n-ブチルアミノ等が挙げられる。

[0099]

好ましくは、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ及びn-ブチルアミノが挙げられる。

[0100]

ジC1-6アルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピ ルアミノ、ジ-i-プロピルアミノ、ジ-c-プロピルアミノ、ジ-n-ブチルアミノ、ジ-i-ブチ ルアミノ、ジ-s-ブチルアミノ、ジ-t-ブチルアミノ、ジ-c-ブチルアミノ、ジ-1-ペンチル アミノ、ジ-2-ペンチルアミノ、ジ-3-ペンチルアミノ、ジ-i-ペンチルアミノ、ジ-ネオペ ンチルアミノ、ジ-t-ペンチルアミノ、ジ-c-ペンチルアミノ、ジ-1-ヘキシルアミノ、ジ-2-ヘキシルアミノ、ジ-3-ヘキシルアミノ、ジ-c-ヘキシルアミノ、ジ-(1-メチル-n-ペン チル) アミノ、ジ-(1,1,2-トリメチル-n-プロピル) アミノ、ジ-(1,2,2-トリメチル-n-プロ ピル)アミノ、ジ-(3,3-ジメチル-n-ブチル)アミノ、メチル(エチル)アミノ、メチル(n-プ ロピル)アミノ、メチル(i-プロピル)アミノ、メチル(c-プロピル)アミノ、メチル(n-ブチ ル)アミノ、メチル(i-ブチル)アミノ、メチル(s-ブチル)アミノ、メチル(t-ブチル)アミ ノ、メチル(c-ブチル)アミノ、エチル(n-プロピル)アミノ、エチル(i-プロピル)アミノ、 エチル(c-プロピル)アミノ、エチル(n-ブチル)アミノ、エチル(i-ブチル)アミノ、エチル (s-ブチル)アミノ、エチル(t-ブチル)アミノ、エチル(c-ブチル)アミノ、n-プロピル(i-プロピル)アミノ、n-プロピル(c-プロピル)アミノ、n-プロピル(n-ブチル)アミノ、n-プ ロピル(i-ブチル)アミノ、n-プロピル(s-ブチル)アミノ、n-プロピル(t-ブチル)アミノ、 n-プロピル(c-ブチル)アミノ、i-プロピル(c-プロピル)アミノ、i-プロピル(n-ブチル)ア ミノ、i-プロピル(i-ブチル)アミノ、i-プロピル(s-ブチル)アミノ、i-プロピル(t-ブチ ル)アミノ、i-プロピル(c-ブチル)アミノ、c-プロピル(n-ブチル)アミノ、c-プロピル(i-ブチル)アミノ、c-プロピル(s-ブチル)アミノ、c-プロピル(t-ブチル)アミノ、c-プロピ ν (c-ブチル)アミノ、n-ブチル(i-ブチル)アミノ、n-ブチル(s-ブチル)アミノ、n-ブチル (t-ブチル)アミノ、n-ブチル(c-ブチル)アミノ、i-ブチル(s-ブチル)アミノ、i-ブチル(t--ブチル)アミノ、i-ブチル(c-ブチル)アミノ、s-ブチル(t-ブチル)アミノ、s-ブチル(c-ブチル)アミノ及びt-ブチル(c-ブチル)アミノ等が挙げられる。

[0101]

 \bar{G} 好ましくは、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピルアミノ、ジ-i-プロピルアミノ及びジ-n-ブチルアミノが挙げられる。

[0102]

 C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基としては、メチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、n-プロピルカルボニルアミノ、i-プロピルカルボニルアミノ、n-ブチルカルボニルアミノ、i-ブチルカルボニルアミノ、i-ブチルカルボニルアミノ、i-ブチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペキシルカルボニルアミノ及びi-ペキシルカルボニルアミノ等が挙げられる。

[0103]

好ましくは、メチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、n-プロピルカルボニルアミノ、i-プロピルカルボニルアミノ及びn-ブチルカルボニルアミノが挙げられる。

[0104]

 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基としては、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、n-プロピルスルホニルアミノ、i-プロピルスルホニルアミノ、n-ブチルスルホニルアミノ、i-ブチルスルホニルアミノ、i-ブチルスルホニルアミノ、i-ブチルスルホニルアミノ、i-ペンチルスルホニルアミ

ンチルスルホニルアミノ、1-ヘキシルスルホニルアミノ、2-ヘキシルスルホニルアミノ及び3-ヘキシルスルホニルアミノ等が挙げられる。

[0105]

好ましくは、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、n-プロピルスルホニルアミノ、i-プロピルスルホニルアミノ及びn-ブチルスルホニルアミノが挙げられる。

[0106]

 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基としては、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n-プロピルアミノカルボニル、i-プロピルアミノカルボニル、n-ブチルアミノカルボニル、i-ブチルアミノカルボニル、i-ブチルアミノカルボニル、i-ブチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペンチルアミノカルボニル、i-ペキシルアミノカルボニル及びi-ヘキシルアミノカルボニル等が挙げられる。

[0107]

好ましくは、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n-プロピルアミノカルボニル、i-プロピルアミノカルボニル及びn-ブチルアミノカルボニルが挙げられる。

[0108]

ジC1 - 6 アルキルアミノカルボニル基としては、ジメチルアミノカルボニル、ジエチ ルアミノカルボニル、ジ-n-プロピルアミノカルボニル、ジ-i-プロピルアミノカルボニル 、ジ-c-プロピルアミノカルボニル、ジ-n-ブチルアミノカルボニル、ジ-i-ブチルアミノ カルボニル、ジ-s-ブチルアミノカルボニル、ジ-t-ブチルアミノカルボニル、ジ-c-ブチ ルアミノカルボニル、ジ-1-ペンチルアミノカルボニル、ジ-2-ペンチルアミノカルボニル 、ジ-3-ペンチルアミノカルボニル、ジ-i-ペンチルアミノカルボニル、ジ-ネオペンチル アミノカルボニル、ジ-t-ペンチルアミノカルボニル、ジ-c-ペンチルアミノカルボニル、 ジ-1-ヘキシルアミノカルボニル、ジ-2-ヘキシルアミノカルボニル、ジ-3-ヘキシルアミ ノカルボニル、ジ-c-ヘキシルアミノカルボニル、ジ-(1-メチル-n-ペンチル)アミノカル ボニル、ジ-(1,1,2-トリメチル-n-プロピル)アミノカルボニル、ジ-(1,2,2-トリメチル-n-プロピル)アミノカルボニル、ジ-(3,3-ジメチル-n-ブチル)アミノカルボニル、メチル(エチル)アミノカルボニル、メチル(n-プロピル)アミノカルボニル、メチル(i-プロピル) アミノカルボニル、メチル(c-プロピル)アミノカルボニル、メチル(n-ブチル)アミノカル ボニル、メチル(i-ブチル)アミノカルボニル、メチル(s-ブチル)アミノカルボニル、メチ ル(t-ブチル)アミノカルボニル、メチル(c-ブチル)アミノカルボニル、エチル(n-プロピ ル)アミノカルボニル、エチル(i-プロピル)アミノカルボニル、エチル(c-プロピル)アミ ノカルボニル、エチル(n-ブチル)アミノカルボニル、エチル(i-ブチル)アミノカルボニル 、エチル(s-ブチル)アミノカルボニル、エチル(t-ブチル)アミノカルボニル、エチル(c-ブチル)アミノカルボニル、n-プロピル(i-プロピル)アミノカルボニル、n-プロピル(c-プ ロピル)アミノカルボニル、n-プロピル(n-ブチル)アミノカルボニル、n-プロピル(i-ブチ ル)アミノカルボニル、n-プロピル(s-ブチル)アミノカルボニル、n-プロピル(t-ブチル) アミノカルボニル、n-プロピル(c-ブチル)アミノカルボニル、i-プロピル(c-プロピル)ア ミノカルボニル、i-プロピル(n-ブチル)アミノカルボニル、i-プロピル(i-ブチル)アミノ カルボニル、i-プロピル(s-ブチル)アミノカルボニル、i-プロピル(t-ブチル)アミノカル ボニル、i-プロピル(c-ブチル)アミノカルボニル、c-プロピル(n-ブチル)アミノカルボニ ル、c-プロピル(i-ブチル)アミノカルボニル、c-プロピル(s-ブチル)アミノカルボニル、 c-プロピル(t-ブチル)アミノカルボニル、c-プロピル(c-ブチル)アミノカルボニル、n-ブ チル(i-ブチル)アミノカルボニル、n-ブチル(s-ブチル)アミノカルボニル、n-ブチル(t-ブチル)アミノカルボニル、n-ブチル(c-ブチル)アミノカルボニル、i-ブチル(s-ブチル) アミノカルボニル、i-ブチル(t-ブチル)アミノカルボニル、i-ブチル(c-ブチル)アミノカ ルボニル、s-ブチル(t-ブチル)アミノカルボニル、s-ブチル(c-ブチル)アミノカルボニル 及びt-ブチル(c-ブチル)アミノカルボニル等が挙げられる。

[0109]

好ましくは、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジ-n-プロピルアミノカルボニル、ジ-i-プロピルアミノカルボニル、ジ-c-プロピルアミノカルボニル及びジ-n-ブチルアミノカルボニルが挙げられる。

[0110]

 C_{1-6} アルキルカルボニル基としては、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル、n-ブチルカルボニル、i-ブチルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル

[0111]

好ましくは、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル及びn-ブチルカルボニルが挙げられる。

[0112]

C₃₋₈シクロアルキルカルボニル基としては、c-プロピルカルボニル、c-ブチルカルボニ ル、1-メチル-c-プロピルカルボニル、2-メチル-c-プロピルカルボニル、c-ペンチルカル ボニル、1-メチル-c-ブチルカルボニル、2-メチル-c-ブチルカルボニル、3-メチル-c-ブ チルカルボニル、1,2-ジメチル-c-プロピルカルボニル、2,3-ジメチル-c-プロピルカルボ ニル、1-エチル-c-プロピルカルボニル、2-エチル-c-プロピルカルボニル、c-ヘキシルカ ルボニル、c-ヘプチルカルボニル、c-オクチルカルボニル、1-メチル-c-ヘキシルカルボ ニル、2-メチル-c-ヘキシルカルボニル、3-メチル-c-ヘキシルカルボニル、1,2-ジメチル -c-ヘキシルカルボニル、2,3-ジメチル-c-プロピルカルボニル、1-エチル-c-プロピルカ ルボニル、1-メチル-c-ペンチルカルボニル、2-メチル-c-ペンチルカルボニル、3-メチル -c-ペンチルカルボニル、1-エチル-c-ブチルカルボニル、2-エチル-c-ブチルカルボニル 、3-エチル-c-ブチルカルボニル、1,2-ジメチル-c-ブチルカルボニル、1,3-ジメチル-c-ブチルカルボニル、2,2-ジメチル-c-ブチルカルボニル、2,3-ジメチル-c-ブチルカルボニ ル、2,4-ジメチル-c-ブチルカルボニル、3,3-ジメチル-c-ブチルカルボニル、1-n-プロピ ν_{-c-} プロピルカルボニル、2-n-プロピル-c-プロピルカルボニル、1-i-プロピル-c-プロ ピルカルボニル、2-i-プロピル-c-プロピルカルボニル、1,2,2-トリメチル-c-プロピルカ ルボニル、1,2,3-トリメチル-c-プロピルカルボニル、2,2,3-トリメチル-c-プロピルカル ボニル、1-エチル-2-メチル-c-プロピルカルボニル、2-エチル-1-メチル-c-プロピルカル ボニル、2-エチル-2-メチル-c-プロピルカルボニル及び2-エチル-3-メチル-c-プロピルカ ルボニル等が挙げられる。

[0113]

好ましくは c -ペンチルカルボニル及びc-ヘキシルカルボニルが挙げられる。

[0114]

 C_{1-6} アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、i-プトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニル、t-ベンチルオキシカルボニルをが挙げられる。

[0115]

好ましくは、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、i-ブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル及びt-ブトキシカルボニルが挙げられる。

[0116]

 C_{1-6} アルキルスルホニル基としては、メタンスルホニル、トリフルオロメタンスルホニル及びエタンスルホニルが挙げられる。

[0117]

 C_{6-14} アリールカルボニル基としては、フェニルカルボニル、O-ビフェニリルカルボニル、m-ビフェニリルカルボニル、p-ビフェニリルカルボニル、 α -ナフチルカルボニル、 β -ナフチルカルボニル、1-アントリルカルボニル、2-アントリルカルボニル、9-アントリルカルボニル、1-フェナントリルカルボニル、2-フェナントリルカルボニル、3-フェナントリルカルボニル、4-フェナントリルカルボニル及び9-フェナントリルカルボニル等が挙げられる。

[0118]

好ましくは、フェニルカルボニル、ο-ビフェニリルカルボニル、m-ビフェニリルカルボニル、p-ビフェニリルカルボニル及び α-ナフチルカルボニル、β-ナフチルカルボニル等が挙げられる。

[0119]

 C_{2-9} へテロアリールカルボニル基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$ 員環までの C_{2-6} 単環式複素環カルボニル基及び構成原子数が $8\sim1$ 0までの C_{5-9} 縮合二環式複素環カルボニル基が含まれる。

[0120]

 $5 \sim 7$ 員環までの C_{2-6} 単環式複素環カルボニル基としては、2-チエニルカルボニル 基、3-チエニルカルボニル基、2-フリルカルボニル基、3-フリルカルボニル基、2 - ピラニルカルボニル基、3 - ピラニルカルボニル基、4 - ピラニルカルボニル基、1 -ピロリルカルボニル基、2-ピロリルカルボニル基、3-ピロリルカルボニル基、1-イ ミダゾリルカルボニル基、2-イミダゾリルカルボニル基、4-イミダゾリルカルボニル 基、1-ピラゾリルカルボニル基、3-ピラゾリルカルボニル基、4-ピラゾリルカルボ ニル基、2-チアゾリルカルボニル基、4-チアゾリルカルボニル基、5-チアゾリルカ ルボニル基、3-イソチアゾリルカルボニル基、4-イソチアゾリルカルボニル基、5-イソチアゾリルカルボニル基、2-オキサゾリルカルボニル基、4-オキサゾリルカルボ ニル基、5-オキサゾリルカルボニル基、3-イソオキサゾリルカルボニル基、4-イソ オキサゾリルカルボニル基、5-イソオキサゾリルカルボニル基、2-ピリジルカルボニ ル基、3-ピリジルカルボニル基、4-ピリジルカルボニル基、2-ピラジニルカルボニ ル基、2-ピリミジニルカルボニル基、4-ピリミジニルカルボニル基、5-ピリミジニ ルカルボニル基、3-ピリダジニルカルボニル基、4-ピリダジニルカルボニル基、2-1, 3, 4-オキサジアゾリルカルボニル基、2-1, 3, 4-チアジアゾリルカルボニ ル基、3-1,2,4-オキサジアゾリルカルボニル基、5-1,2,4-オキサジアゾ リルカルボニル基、3-1, 2, 4-チアジアゾリルカルボニル基、<math>5-1, 2, 4-チアジアゾリルカルボニル基、3-1, 2, 5-オキサジアゾリルカルボニル基及び3-1, 2, 5-チアジアゾリルカルボニル基等が挙げられる。

[0121]

構成原子数が $8\sim1$ 0までの C_{5-9} 縮合二環式複素環カルボニル基としては、2-ベンゾフラニルカルボニル基、3-ベンゾフラニルカルボニル基、4-ベンゾフラニルカルボニル基、7-ベンゾフラニルカルボニル基、4-インベンゾフラニルカルボニル基、7-ベンゾフラニルカルボニル基、1-インベンゾフラニルカルボニル基、1-インベンゾフラニルカルボニル基、1-インベンゾフラニルカルボニル基、1-インベンゾフラニルカルボニル基、1-ベンゾチエニルカルボニル基、1-ベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インドリジニルカルボニル基、1-インドリ

ジニルカルボニル基、8-インドリジニルカルボニル基、1-イソインドリルカルボニル 基、2-イソインドリルカルボニル基、4-イソインドリルカルボニル基、5-イソイン ドリルカルボニル基、1-インドリルカルボニル基、2-インドリルカルボニル基、3-インドリルカルボニル基、4ーインドリルカルボニル基、5ーインドリルカルボニル基、 6-インドリルカルボニル基、7-インドリルカルボニル基、1-インダゾリルカルボニ ル基、2-インダゾリルカルボニル基、3-インダゾリルカルボニル基、4-インダゾリ ルカルボニル基、5-インダゾリルカルボニル基、6-インダゾリルカルボニル基、7-インダゾリルカルボニル基、1-プリニルカルボニル基、2-プリニルカルボニル基、3 ープリニルカルボニル基、6ープリニルカルボニル基、7ープリニルカルボニル基、8ー プリニルカルボニル基、2ーキノリルカルボニル基、3ーキノリルカルボニル基、4ーキ ノリルカルボニル基、5-キノリルカルボニル基、6-キノリルカルボニル基、7-キノ リルカルボニル基、8-キノリルカルボニル基、1-イソキノリルカルボニル基、3-イ ソキノリルカルボニル基、4-イソキノリルカルボニル基、5-イソキノリルカルボニル 基、6-イソキノリルカルボニル基、7-イソキノリルカルボニル基、8-イソキノリル カルボニル基、1-フタラジニルカルボニル基、5-フタラジニルカルボニル基、6-フ タラジニルカルボニル基、1-2、7-ナフチリジニルカルボニル基、3-2,7-ナフ チリジニルカルボニル基、4-2,7-ナフチリジニルカルボニル基、1-2,6-ナフチ リジニルカルボニル基、3-2,6-ナフチリジニルカルボニル基、4-2,6-ナフチリ ジニルカルボニル基、2-1,8-ナフチリジニルカルボニル基、3-1,8-ナフチリジ ニルカルボニル基、4-1,8-ナフチリジニルカルボニル基、2-1,7-ナフチリジニ ルカルボニル基、3-1,7-ナフチリジニルカルボニル基、4-1,7-ナフチリジニル カルボニル基、5-1,7-ナフチリジニルカルボニル基、6-1,7-ナフチリジニルカ ルボニル基、8-1,7-ナフチリジニルカルボニル基、2-1,6-ナフチリジニルカル ボニル基、3-1,6-ナフチリジニルカルボニル基、4-1,6-ナフチリジニルカルボ ニル基、5-1,6-ナフチリジニルカルボニル基、7-1,6-ナフチリジニルカルボニ ル基、8-1.6-ナフチリジニルカルボニル基、2-1,5-ナフチリジニルカルボニル 基、3-1,5-ナフチリジニルカルボニル基、4-1,5-ナフチリジニルカルボニル基 、6-1,5-ナフチリジニルカルボニル基、7-1,5-ナフチリジニルカルボニル基、 8-1.5-ナフチリジニルカルボニル基、2-キノキサリニルカルボニル基、5-キノ キサリニルカルボニル基、6-キノキサリニルカルボニル基、2-キナゾリニルカルボニ ル基、4-キナゾリニルカルボニル基、5-キナゾリニルカルボニル基、6-キナゾリニ ルカルボニル基、7-キナゾリニルカルボニル基、8-キナゾリニルカルボニル基、3-シンノリニルカルボニル基、4-シンノリニルカルボニル基、5-シンノリニルカルボニ ル基、6-シンノリニルカルボニル基、7-シンノリニルカルボニル基、8-シンノリニ ルカルボニル基、2ープテリジニルカルボニル基、4ープテリジニルカルボニル基、6ー プテリジニルカルボニル基及び7-プテリジニルカルボニル基等が挙げられる。

$[0 \ 1 \ 2 \ 2]$

好ましくは、2-ピリジルカルボニル基、3-ピリジルカルボニル及び基4-ピリジルカルボニル基が挙げられる。

[0123]

 C_{6-14} アリールスルホニル基としては、フェニルスルホニル、O-ビフェニリルスルホニル、m-ビフェニリルスルホニル、p-ビフェニリルスルホニル、 α -ナフチルスルホニル、 β -ナフチルスルホニル、1-アントリルスルホニル、2-アントリルスルホニル、9-アントリルスルホニル、1-フェナントリルスルホニル、2-フェナントリルスルホニル、3-フェナントリルスルホニル、4-フェナントリルスルホニルをび9-フェナントリルスルホニル等が挙げられる。

[0124]

好ましくは、フェニルスルホニル、o-ビフェニリルスルホニル、m-ビフェニリルスルホニル、p-ビフェニリルスルホニル及び α -ナフチルスルホニル、 β -ナフチルスルホニル等が挙げられる。

[0125]

 C_{2-9} ヘテロアリールスルホニル基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$ 員環までの C_{2-6} 単環式複素環スルホニル基及び構成原子数が $8\sim1$ 0までの C_{5-9} 縮合二環式複素環スルホニル基が含まれる。

[0126]

5~7員環までのC₂₋₆単環式複素環スルホニル基としては、2-チエニルスルホニル 基、3-チエニルスルホニル基、2-フリルスルホニル基、3-フリルスルホニル基、2 - ピラニルスルホニル基、3 - ピラニルスルホニル基、4 - ピラニルスルホニル基、1 -ピロリルスルホニル基、2-ピロリルスルホニル基、3-ピロリルスルホニル基、1-イ ミダゾリルスルホニル基、2-イミダゾリルスルホニル基、4-イミダゾリルスルホニル 基、1-ピラゾリルスルホニル基、3-ピラゾリルスルホニル基、4-ピラゾリルスルホ ニル基、2-チアゾリルスルホニル基、4-チアゾリルスルホニル基、5-チアゾリルス ルホニル基、3-イソチアゾリルスルホニル基、4-イソチアゾリルスルホニル基、5-イソチアゾリルスルホニル基、2-オキサゾリルスルホニル基、4-オキサゾリルスルホ ニル基、5-オキサゾリルスルホニル基、3-イソオキサゾリルスルホニル基、4-イソ オキサゾリルスルホニル基、5-イソオキサゾリルスルホニル基、2-ピリジルスルホニ ル基、3-ピリジルスルホニル基、4-ピリジルスルホニル基、2-ピラジニルスルホニ ル基、2-ピリミジニルスルホニル基、4-ピリミジニルスルホニル基、5-ピリミジニ ルスルホニル基、3-ピリダジニルスルホニル基、4-ピリダジニルスルホニル基、2-1, 3, 4-オキサジアゾリルスルホニル基、2-1, 3, 4-チアジアゾリルスルホニ ル基、3-1,2,4-オキサジアゾリルスルホニル基、5-1,2,4-オキサジアゾ リルスルホニル基、3-1,2,4-チアジアゾリルスルホニル基、5-1,2,4-チ アジアゾリルスルホニル基、3-1,2,5-オキサジアゾリルスルホニル基及び3-1 , 2, 5-チアジアゾリルスルホニル基等が挙げられる。

[0127]

構成原子数が8~10までの C_{5-9} 縮合二環式複素環スルホニル基としては、2-ベンゾフラニルスルホニル基、3-ベンゾフラニルスルホニル基、4-ベンゾフラニルスルホ ニル基、5-ベンゾフラニルスルホニル基、6-ベンゾフラニルスルホニル基、7-ベン ゾフラニルスルホニル基、1-イソベンゾフラニルスルホニル基、4-イソベンゾフラニ ルスルホニル基、5-イソベンゾフラニルスルホニル基、2-ベンゾチエニルスルホニル 基、3-ベンゾチエニルスルホニル基、4-ベンゾチエニルスルホニル基、5-ベンゾチ エニルスルホニル基、6-ベンゾチエニルスルホニル基、7-ベンゾチエニルスルホニル 基、1-イソベンゾチエニルスルホニル基、4-イソベンゾチエニルスルホニル基、5-イソベンゾチエニルスルホニル基、2-クロメニルスルホニル基、3-クロメニルスルホ ニル基、4-クロメニルスルホニル基、5-クロメニルスルホニル基、6-クロメニルス ルホニル基、7-クロメニルスルホニル基、8-クロメニルスルホニル基、1-インドリ ジニルスルホニル基、2ーインドリジニルスルホニル基、3ーインドリジニルスルホニル 基、5-インドリジニルスルホニル基、6-インドリジニルスルホニル基、7-インドリ ジニルスルホニル基、8-インドリジニルスルホニル基、1-イソインドリルスルホニル 基、2-イソインドリルスルホニル基、4-イソインドリルスルホニル基、5-イソイン ドリルスルホニル基、1-インドリルスルホニル基、2-インドリルスルホニル基、3-インドリルスルホニル基、4-インドリルスルホニル基、5-インドリルスルホニル基、 6-インドリルスルホニル基、7-インドリルスルホニル基、1-インダゾリルスルホニ ル基、2-インダゾリルスルホニル基、3-インダゾリルスルホニル基、4-インダゾリ ルスルホニル基、5-インダゾリルスルホニル基、6-インダゾリルスルホニル基、7-インダゾリルスルホニル基、1-プリニルスルホニル基、2-プリニルスルホニル基、3 ープリニルスルホニル基、6ープリニルスルホニル基、7ープリニルスルホニル基、8ー プリニルスルホニル基、2-キノリルスルホニル基、3-キノリルスルホニル基、4-キ ノリルスルホニル基、5-キノリルスルホニル基、6-キノリルスルホニル基、7-キノ リルスルホニル基、8-キノリルスルホニル基、1-イソキノリルスルホニル基、3-イ ソキノリルスルホニル基、4-イソキノリルスルホニル基、5-イソキノリルスルホニル 基、6-イソキノリルスルホニル基、7-イソキノリルスルホニル基、8-イソキノリル スルホニル基、1-フタラジニルスルホニル基、5-フタラジニルスルホニル基、6-フ タラジニルスルホニル基、1-2、7-ナフチリジニルスルホニル基、3-2,7-ナフ チリジニルスルホニル基、4-2,7-ナフチリジニルスルホニル基、1-2,6-ナフチ リジニルスルホニル基、3-2,6-ナフチリジニルスルホニル基、4-2,6-ナフチリ ジニルスルホニル基、2-1,8-ナフチリジニルスルホニル基、3-1,8-ナフチリジ ニルスルホニル基、4-1,8-ナフチリジニルスルホニル基、2-1,7-ナフチリジニ ルスルホニル基、3-1,7-ナフチリジニルスルホニル基、4-1,7-ナフチリジニル スルホニル基、5-1,7-ナフチリジニルスルホニル基、6-1,7-ナフチリジニルス ルホニル基、8-1,7-ナフチリジニルスルホニル基、2-1,6-ナフチリジニルスル ホニル基、3-1.6-ナフチリジニルスルホニル基、4-1,6-ナフチリジニルスルホ ニル基、5-1,6-ナフチリジニルスルホニル基、7-1,6-ナフチリジニルスルホニ ル基、8-1,6-ナフチリジニルスルホニル基、2-1,5-ナフチリジニルスルホニル 基、3-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、4-1,5-ナフチリジニルスルホニル基 、6-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、7-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、 8-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、2-キノキサリニルスルホニル基、5-キノ キサリニルスルホニル基、6-キノキサリニルスルホニル基、2-キナゾリニルスルホニ ル基、4-キナゾリニルスルホニル基、5-キナゾリニルスルホニル基、6-キナゾリニ ルスルホニル基、7-キナゾリニルスルホニル基、8-キナゾリニルスルホニル基、3-シンノリニルスルホニル基、4-シンノリニルスルホニル基、5-シンノリニルスルホニ ル基、6-シンノリニルスルホニル基、7-シンノリニルスルホニル基、8-シンノリニ ルスルホニル基、2ープテリジニルスルホニル基、4ープテリジニルスルホニル基、6ー プテリジニルスルホニル基及び7ープテリジニルスルホニル基等が挙げられる。

[0128]

好ましくは、2-ピリジルスルホニル基、3-ピリジルスルホニル及び基4-ピリジルスルホニル基が挙げられる。

[0129]

 C_{6-14} アリールアミノ基としては、フェニルアミノ、O-ビフェニリルアミノ、M-ビフェニリルアミノ、D-ビフェニリルアミノ、D-ビフェニリルアミノ、D-ビフェニリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ、D-アントリルアミノ等が挙げられる。

[0130]

好ましくは、フェニルアミノ、o-ビフェニリルアミノ、m-ビフェニリルアミノ、p-ビフェニリルアミノ及び α -ナフチルアミノ、β -ナフチルアミノ等が挙げられる。

[0131]

 C_{2-9} へテロアリールアミノ基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$ 員環までの C_{2-6} 単環式複素環アミノ基及び構成原子数が $8\sim1$ 0までの C_{5-9} 縮合二環式複素環アミノ基が含まれる。

[0132]

 $5\sim7$ 員環までの C_{2-6} 単環式複素環アミノ基としては、2-f エニルアミノ基、3-f チエニルアミノ基、2-f リルアミノ基、2-f アゾリルアミノ基、2-f アゾリルアミノ

[0133]

構成原子数が8~10までの C_{5-9} 縮合二環式複素環アミノ基としては、2-ベンゾフ ラニルアミノ基、3-ベンゾフラニルアミノ基、4-ベンゾフラニルアミノ基、5-ベン ゾフラニルアミノ基、6-ベンゾフラニルアミノ基、7-ベンゾフラニルアミノ基、1-イソベンゾフラニルアミノ基、4-イソベンゾフラニルアミノ基、5-イソベンゾフラニ ルアミノ基、2-ベンゾチエニルアミノ基、3-ベンゾチエニルアミノ基、4-ベンゾチ エニルアミノ基、5-ベンゾチエニルアミノ基、6-ベンゾチエニルアミノ基、7-ベン ゾチエニルアミノ基、1-イソベンゾチエニルアミノ基、4-イソベンゾチエニルアミノ 基、5-イソベンゾチエニルアミノ基、2-クロメニルアミノ基、3-クロメニルアミノ 基、4-クロメニルアミノ基、5-クロメニルアミノ基、6-クロメニルアミノ基、7-クロメニルアミノ基、8-クロメニルアミノ基、1-インドリジニルアミノ基、2-イン ドリジニルアミノ基、3-インドリジニルアミノ基、5-インドリジニルアミノ基、6-インドリジニルアミノ基、7-インドリジニルアミノ基、8-インドリジニルアミノ基、 1-イソインドリルアミノ基、2-イソインドリルアミノ基、4-イソインドリルアミノ 基、5-イソインドリルアミノ基、1-インドリルアミノ基、2-インドリルアミノ基、 3-インドリルアミノ基、4-インドリルアミノ基、5-インドリルアミノ基、6-イン ドリルアミノ基、7-インドリルアミノ基、1-インダゾリルアミノ基、2-インダゾリ ルアミノ基、3-インダゾリルアミノ基、4-インダゾリルアミノ基、5-インダゾリル アミノ基、6-インダゾリルアミノ基、7-インダゾリルアミノ基、1-プリニルアミノ 基、2-プリニルアミノ基、3-プリニルアミノ基、6-プリニルアミノ基、7-プリニ ルアミノ基、8-プリニルアミノ基、2-キノリルアミノ基、3-キノリルアミノ基、4 ーキノリルアミノ基、5ーキノリルアミノ基、6ーキノリルアミノ基、7ーキノリルアミ ノ基、8-キノリルアミノ基、1-イソキノリルアミノ基、3-イソキノリルアミノ基、 4-イソキノリルアミノ基、5-イソキノリルアミノ基、6-イソキノリルアミノ基、7 ーイソキノリルアミノ基、8-イソキノリルアミノ基、1-フタラジニルアミノ基、5-フタラジニルアミノ基、6-フタラジニルアミノ基、1-2、7-ナフチリジニルアミノ 基、3-2,7-ナフチリジニルアミノ基、4-2,7-ナフチリジニルアミノ基、1-2, 6 ーナフチリジニルアミノ基、3 ー 2 , 6 ーナフチリジニルアミノ基、4 ー 2 , 6 ーナフ チリジニルアミノ基、2-1,8-ナフチリジニルアミノ基、3-1,8-ナフチリジニル アミノ基、4-1,8-ナフチリジニルアミノ基、2-1,7-ナフチリジニルアミノ基、 3-1, 7-ナフチリジニルアミノ基、4-1, 7-ナフチリジニルアミノ基、5-1, 7ーナフチリジニルアミノ基、6-1,7-ナフチリジニルアミノ基、8-1,7-ナフチリ ジニルアミノ基、2-1,6-ナフチリジニルアミノ基、3-1,6-ナフチリジニルアミ ノ基、4-1,6-ナフチリジニルアミノ基、5-1,6-ナフチリジニルアミノ基、7-1,6-ナフチリジニルアミノ基、8-1,6-ナフチリジニルアミノ基、2-1,5-ナ フチリジニルアミノ基、3-1,5-ナフチリジニルアミノ基、4-1,5-ナフチリジニ ルアミノ基、6-1,5-ナフチリジニルアミノ基、7-1,5-ナフチリジニルアミノ基 、8-1,5-ナフチリジニルアミノ基、2-キノキサリニルアミノ基、5-キノキサリ ニルアミノ基、6-キノキサリニルアミノ基、2-キナゾリニルアミノ基、4-キナゾリ ニルアミノ基、5-キナゾリニルアミノ基、6-キナゾリニルアミノ基、7-キナゾリニ ルアミノ基、8-キナゾリニルアミノ基、3-シンノリニルアミノ基、4-シンノリニル アミノ基、5-シンノリニルアミノ基、<math>6-シンノリニルアミノ基、7-シンノリニルアミノ基、8-シンノリニルアミノ基、2-プテリジニルアミノ基、4-プテリジニルアミノ基、 <math>0-プテリジニルアミノ基及び7-プテリジニルアミノ基等が挙げられる。

[0134]

好ましくは、2-ピリジルアミノ基、3-ピリジルアミノ及び基4-ピリジルアミノ基が挙げられる。

[0135]

本発明に用いられる化合物の置換基の好ましい具体例について説明する。

[0136]

R¹ 及びR² の好ましい具体例としては、メチルが挙げられる。

[0137]

R³ の好ましい具体例としては、水酸基が挙げられる。

[0138]

R⁴ の好ましい具体例としては、水素原子が挙げられる。

[0139]

R⁵ の好ましい具体例としては、水素原子が挙げられる。

[0140]

0

 $N-(CH_2)_m-V-(CH_2)_n-R^6$ の好ましい具体例としては、以下に示す1) ~ 4)が挙げられる

[0156]

本発明に用いられる好ましい化合物としては、以下に示す化合物が挙げられる。

[0157]

 R^1 及び R^2 が、共にメチル基であり、 R^3 が水酸基であり、 R^4 が水素原子であ る式(I)又は式(II)で表されるベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩

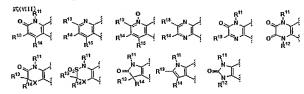
[0158]

式 (I) である上記 (1) 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容さ 出証特2005-3008820 れ得る塩。

[0159]

- (3) Vが結合であり、mが 1 から 3 の整数であり、n が 0 又は 1 であり、 R^6 がベンゼン環である上記(2)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0160]
- (4) Vが $CR^7R^8(R^7$ は水産基、 R^8 は水素原子である。)であり、mが0又は1である上記 (3) 記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0161]
- (5) R^6 がアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキニル基である上記(3)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0162]
- (6) Vが $\mathbb{CR}^7 \mathbb{R}^8 (\mathbb{R}^7 \mathbf{t}$ 水酸基、 $\mathbb{R}^8 \mathbf{t}$ 水素原子である。)であり、 \mathbf{m} が 0 又は 1 である、上記(5)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0163]
- (7) Aが式 (VIII) である、上記 (3) 記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0164]

【化18】



[0165]

- (8) Aが式 (VIII) である、上記 (4) 記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0166]
- (9) Aが式 (VIII) である、上記 (5) 記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0167]
- (10) Aが式 (VIII) である、上記(6)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
 - [0168]

以下に、本発明に用いることができる化合物の具体例を示すが、本発明はこれらに制限されるものではない。なお、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Ac」はアセチル基(COCH3)を、「-」は結合をそれぞれ意味する。

[0169]

【表1】

HN -R			
ни	niv y	IN~~\N	HN N
HN~~~	óн [] '	IN \	
HN	HN		HN
HN	НИ	HN	F HN N
	HN	HN^C	HN~N
HN	NH ₂	HN	HN~~S~
HN	HN F	· · · · ·	HN
HN	hn HN	HN COOH	HN~°C
HN ~) HN	HN \	HN
	`	NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	N=>-cl
HN	HN	HN	HN
HNOH	HN \		HN~N
HN	HN	NOH	
10	1 7 0 1		

【0170】 【表2】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R13	R ¹⁴	F	₂ 11	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	Н	NO ₂	Н		Н	Н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHO	Н		Н	Н	CHO
н	Н	n₽r	н	SO₃H	Н		H	н	SO₃H
H	Н	nBu	н	сī	Н		Н	н	Cl
н	н	tBu	Н	Br	н		Н	н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н		Иe	н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н		Иe	н	CH_2NH_2
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н		Иe	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	H	Me	CH₂Ph	н		Иe	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Иe	н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		Мe	н	COOH
Et	Ph	н	Εt	CONH ₂	Н		Εt	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Εt	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	1	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		ıBu	tBu	NO2
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		:Bu	Ph	н
Ph	Cl	Et	Ph	so₃H	Et		₽h	Et	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		120H	nPr	Н
CH₂OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		1 ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI		₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		H_2NH_2	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		H_2NH_2	Et	Н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		$12NH_2$	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		1_2NH_2	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me		₂NHMe	Мe	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Et		H ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		H ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH₂CH₂Ph	COOH	Ph	CH ₂	CH ₂ Ph	Ph	н
	T /	1 7	1 1						

[0171]

【表3】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	н	NO ₂	н	н	н	NO ₂
н	н	iPr	н	CHO	н	н	н	CHO
H	Н	nPr	н	SO ₃ H	Н	н	н	SO₃H
H	н	nBu	Н	a	Н	н	Н	CI
н	н	tBu	Н	Br	Н	н	Н	Br
Me	н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	н	CH ₂ NH ₂
Me	ıPr	Н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	₽h	Н	Et	CONH ₂	Н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	ıPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ıPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	лВи	tBu	NO_2
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Εt	Ph	SO₃H	Et	Ph	Et	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Εt	CI	CH ₂ OM e	COMe	Cl	CH ₂ OMe	CI	CI
CH₂OMe	nPr	Cl	CH ₂ OM e	COOH	CI	CH ₂ OMe	Cl	Cl
CH ₂ NH ₂	Ph	Cl	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	Cl	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH2NH2	Et	Н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	Н	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н
	T	\ T [7	0 1					

【0172】

HN ~~~
ОН
_Me
O Me

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14
Н	н	Et	н	NO ₂	н	н	Н	NO ₂
н	Н	ıPr	н	CHO	Н	н	Н	CHO
н	Н	n₽r	н	SO₃H	Н	н	Н	SO₃H
н	н	nBu	н	ci	Н	н	Н	Cl
н	Н	tBu	Н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me	н	
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Мe	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	n₽r	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO_2	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Εt	Ph	SO₃H	Et	Ph	Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	Cl	CH₂OM e	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH2NH2	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Et	H
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	H
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO_2	Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH ₂ Ph	Εt	Et	CH₂Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Et	H
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	Н	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

[0173]

【表5】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴		R ¹¹	R ¹³	R14
Н	Н	Et	н	NO ₂	н		н	Н	NO₂
H	Н	iPr	Н	CHŌ	н		Н	н	CHO
н	H	nPr	Н	SO ₃ H	Н		Н	Н	so₃H
H	Н	nBu	H	ď	н		Н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Me	н	Ph	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Εt	Ph	Me	CH2NH2	н		Me	н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н		CH ₂ NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	н		Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH₂	н		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Et		Et	Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Εt	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et		Ph	Εt	н
CH ₂ OH	CI	n₽r	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	a	Ph	CH ₂ OH	OH	Ρh		CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	Cl	CH ₂ OMe	COMe	Cl		CH ₂ OMe	CI	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH2NH2	CONH ₂	CI			CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	€t			Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH_2NH_2	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Ме	Me	CH ₂ NHMe	NO_2	Me	(H ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Εt		CH ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	н	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	₽h	CH2CH2Pt	COOH	Ph ——	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
	-		. •						

【0174】

H HN R OH

HN-R			
HN ~~	HN \	ни	HN
HN	ÓH HN	HN O	HN N N
HN	F F	HN~~	, ,
HN	HN	HN \	F HN O
HN	HN	U ✓L _F	HN N
\cap	HN	2 HN	HN O
HN	HN F	HN	HN
HN	HN -	соон	
HN (HN OH	HN NH ₂	HN
HN	HN \	HN HN Me	HN
HN	HN \		HN N CI
HN \	HN	HN	Thomas Ann
ьи Он	HN	N	0
<u> </u>	175]	о́н	

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	Н	NO ₂	н	н	н	NO₂
H	н	iPr	н	CHŌ	Н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	SO ₃ H	Н	н	н	so₃H
H	н	nBu	н	a	Н	н	Н	CI
Н	H	tBu	н	Br	Н	Н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH2NH2
Ме	ıPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	Н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Εt	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	Cl	Εt	Ph	so₃H	Εt	Ph	Eŧ	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	Cl	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	Cl	CH ₂ OM e	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH ₂ OM e	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Εt	Н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	иНМs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н
			- T					

【0176】 【表8】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14
Н	н	Et	Н	NO ₂	Н	н	Н	NO ₂
B	н	iPr	н	CHŌ	Н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	SO₃H	Н	н	Н	SO₃H
н	н	nBu	н	ď	Н	н	Н	CI
H	н	tBu	н	Br	Н	H	Н	Br
Ме	н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me	н	CH ₂ OH
Ме	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	Н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	n₽r	н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Εt	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Εt	ıPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	ıPr	NHMs	nPr	ıPr	n₽r	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHŌ	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Εt	Ph	so₃H	Et	Ph	Et	H
CH ₂ OH	CI	nPr	CH2OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	Cl	Cl
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH2NH2	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH2NH2	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH₂NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH₂Ph	он	Et	CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	n₽r	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	н
	· / ^	1 7	77					

【表 9】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	₽11	E_{13}	R ¹⁴
Н	Н	Et	н	NO ₂	Н	н	Н	NO ₂
н	н	iPr	н	CHO	н	н	Н	CHO
Н	н	nPr	н	SO₃H	н	н	н	so₃H
Н	н	nBu	н	CÎ	Н	н	Н	CI
Н	н	tBu	н	Br	Н	н	н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	H	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH₂Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	иНмѕ
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt	Ph	Εt	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	Cl	Ph	CH ₂ OH	он	Ph	CH ₂ OH	Ph	H
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	Cl	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Εt	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH2CH2Pt	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

【0178】 【表10】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ^{t1}	R ¹³	R ¹⁴
Н	Н	Et	Н	NO ₂	н	н	Н	NO ₂
н	Н	iPr	Н	CHO	Н	н	н	CHO
н	н	nPr	Н	so₃H	Н	н	н	so₃H
Н	н	nBu	н	CI	Н	н	Н	Cl
н	Н	tBu	H	Br	Н	н	Н	Br
Me	н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Εt	Ph	Me	CH2NH2	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	H	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	н	COOH
Et	Ph	H	Et	CONH ₂	Н	Et	Н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	ιPr	Et	CONHMs	íPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	н	n₽r	íPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
пВи	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO_2
tBu	н	₽h	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Et	Ph	Et	н
CH₂OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	Cl	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH2NH2	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	н	n₽r	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Εt	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph		CH2CH2Pt	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

[0179]

HN −R			
HN	HN OH	ни	HN N
HN	HN	HN	
HN \	HN • F	HN~~	!
HN	HN CI		F HN \\^N\\
	HN \	HN	HN
HN	HN	HN N	HN~~S~
HN	F _Y	ĺ	HN O
HN	HN	HN COOH	HN~U
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
l	HN	HN	N N
HN OH	HN		HN~N
HN	HN	NOH	
[0	181		

【表13】

HN H	HN-R			
HN H	HN ~	tha 1	ни~	HN N
HN HN F HN S HN S	HN ~~		HN \	
HN HN S HN	HN		DIN CONTRACTOR	
HN HN S HN O HN	HN			F HN
HN HN COOH HN OH HN O	\Box		11 _1	HN N
HN HN COOH HN N HN HN HN HN N HN CI	HN V		HN \\	HN, 🔷 ,
HN COOH HN H	HN	F		HN O
HN HN HN HN N CI	HN \	HN	HN COOH	HN
HN HN HN HN N CI HN HN HN N CI HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N	HN	HN	HN \	HN
HN HN HN HN N CI	\cap			
HN OH HN N	HN	HM. J.	HN Me	vi ∕>Cl
он он от	ни	HN	HN	HN.
	ни ОН	HN		HN~N
HN HN OH	HN ~	HN \	N OH	

【0182】 【表14】

		1410	
R ¹³	×	R ¹³	х
NO ₂	0	Me	0
CHÖ	0	Εt	0
SO₃H	0	iPr	0
a	0	nPr	0
Br	0	nBu	0
CH ₂ OH	0	tBu	0
CH ₂ NH ₂	0	Ph	0
CH ₂ NHMe	0	CH ₂ Ph	0
CH₂Ph	SO	CH₂CH₂Ph	0
COMe	so	Me	S
COOH	SO	Et	S
CONH ₂	SO	iPr	S
CONHMe	so	nPr	Ş
CONHMs	SO	nBu	S
NHMs	SO	tBu	S
NHCOMe	SO	₽h	S
NO ₂	SO ₂	CH₂Ph	S
CHO	S	CH2CH2Ph	S
SO₃H	S	Me	SO ₂
SO₂NHMe	SO ₂	Et	SO ₂
ОН	so	íPr	SO ₂
COMe	0	nPr	SO ₂
COOH	0	nBu	SO ₂
CONH ₂	0	tBu	SO ₂
CONHMe	0	Ph	SO ₂
CONHMs	Ö	CH ₂ Ph	SO ₂
NHMs	SO ₂	CH2CH2Ph	SO ₂
NO ₂	SO ₂	Me	SO
он	SO ₂	Et	SO
COMe	SO ₂	iPr	SO
COOH	SO ₂	nPr	so

[0183]

R¹³ X R¹³ X NO₂ 0 Me 0 CHO 0 Et 0 SO₃H 0 IPr 0 CI 0 nPr 0 Br 0 nBu 0 CH₂OH 0 IBu 0 CH₂NH₂ 0 Ph 0 CH₂NHMe 0 CH₂Ph 0 COMe SO Me S COH SO Et S CONHMe SO nPr S CONHMe SO nPr S CONHMe SO nBu S NHMS SO IBu S NHCOMe SO Ph S NO2 SO2 CH₂Ph S SO3H S Me SO2 SO4H S Me SO2 OH SO IPr SO2 COMe <th></th> <th></th> <th>Me</th> <th></th>			Me	
CHO O Et O O O O O O O O O O O O O O O O O	R ¹³	Х	R ¹³	х
SO3H O IPr O CI O nPr O Br O nBu O CH2OH O tBu O CH2OH O tBu O CH2NHMe O CH2Ph O COMe SO Me S COOH SO Et S CONHMe SO nPr S CONHME SO nPr S CONHME SO nBu S NHMS SO tBu S NHCOME SO Ph S NHCOME SO Ph S NHOOME SO Ph S SO2H S CH2Ph S SO3H S Me SO2 SO4H S Me SO2 OH SO IPr SO2 COME O nPr SO2 <	NO ₂	0	Me	
CI O nPr O BBU O CH20H O CH2NHME O CH2CH2Ph SO CH2CH2Ph SO CH2CH2Ph SO CH2CH2Ph SO CH2CH2Ph SO CONHME SO CH2CH2Ph SO CONHME SO CH2CH2Ph SO CONHME SO CH2CH2Ph SO CONHME SO CH2CH2Ph SO CH0 S CH2CH2Ph SO CONHME SO CH0 S CH2CH2Ph SO CONHME SO CONHME SO CH2CH2Ph SO CONHME SO CONHM	CHO	0	Et	
Br O nBu O CH₂OH O COME SO CH₂OH O COME SO Et S CONH₂ SO IPr S CONHIME SO nPr S CONHIME SO nBu S NHMS SO nBu S NHMS SO NBU S NHMS SO NBU S NHCOME SO Ph S CH₂CH₂OH S CHO S CH₂CH₂OH S CHO S CH₂CH₂OH S SO₃H S ME SO₂H S ME SO₂C CH₂OH SO IPr SO₂ COME O NPr SO₂ COMH SO IPR SO₂ COMH O NBU SO₂ CONH₂ O LBU SO₂ CONH₂ O LBU SO₂ CONHME O Ph SO₂ CONHME O CONHME O CH₂OH SO₂ CONHME SO₂ COME	SO₃H	0	iPr	-
CH2OH O IBU O CH2NH2 O CH2NH2 O CH2NH2 O CH2CH2Ph O CH2Ph O CH2Ph O COME SO ME S CONH2 SO NHMS SO NHMS SO NHMS SO NHMS SO CH2Ph S CONH2 SO CH2Ph S CONHME SO NHMS SO CH2PH S SO3H S ME SO2 CH2PH S CONHME SO NHMS SO NHMS SO CH2PH S CONHME SO NHMS SO NHMS SO CH2PH S SO2 COME SO2 NHMS SO2 CONH2 O NHMS SO2 CONHME O NHMS SO2 CONHME O Ph SO2 CONHME O Ph SO2 CONHME O Ph SO2 CONHME O CONHMS O CH2Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 COME SO COME SO2 Et SO O COME SO COME SO2 ET SO O COME SO2 ET SO O COME SO2 ET SO O COME SO COME SO COME SO2 ET SO O COME SO O	CI	-	nPr	
CH₂NH2 O Ph O CH₂Ph O CH₂NHMe O CH₂Ph O CH₂Ph O CH₂Ph O COME SO Me S COOH SO Et S CONH2 SO NPr S CONHME SO NPr S CONHMS SO NBU S NHOOM SO CH₂Ph S CONHME SO Ph S SO₂H S ME SO₂ CH₂Ph S SO₂H S ME SO₂ CH₂Ph S CONHME SO NPr S CHO S CH₂CH₂Ph S CONHME SO NPr S CH2CH₂Ph S SO₃H S ME SO₂ CH₂Ph S CONHME SO NPr SO₂ COME SO₂NHME SO NPr SO₂ COME SO₂NHME SO NPr SO₂ COME O NPr SO₂ COME O NPr SO₂ COME O NPr SO₂ CONHME O Ph SO₂ CONHME O CONHME SO₂ CO	Br		nBu	
CH₂NHMe O CH₂Fh O CH₂Ph SO CH₂CH₂Ph O COMe SO Me S COMH SO Et S CONH2 SO iPr S CONHME SO nPr S CONHME SO nPu S CONHMS SO nBu S NHMS SO tBu S NHO2 SO2 CH₂Ph S CHO S CH₂Ph S SO3H S Me SO2 CH SO iPr SO2 COMH SO iPr SO2 COME O nBu SO2 CONHME O nBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHME O CH₂Ph SO2 CONHME O CH₂Ph SO2 CONHME O CH₂Ph S	CH ₂ OH			_
CH₂Ph SO CH₂CH₂Ph O COMe SO Me S COMH SO Et S CONH2 SO iPr S CONHME SO iPr S CONHME SO nPr S CONHME SO nBu S NHMS SO iBu S NHCOME SO Ph S NO2 SO2 CH2Ph S CHO S CH2Ph S SO2HME SO2 Et SO2 COME O nPr SO2 COME O nBu SO2 CONH O nBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHME O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 Et	CH ₂ NH ₂	0	Ph	
COMe SO Me S COOH SO Et S CONH2 SO IPr S CONHME SO NPr S CONHME SO NBU S NHMS SO IBU S NHCOME SO Ph S NO2 SO2 CH2Ph S COHO S CH2PH S SO3H S Me SO2 COM SO IPr SO2 COM O NPr SO2 COM O NPr SO2 COM O NPr SO2 COM O NPr SO2 COMH O NBU SO2 CONHME O PH SO2 CONHME O CH2PH SO2 CONHME O CH2PH SO2 CONHME O PH SO2 CONHME O CH2PH SO2 CONHME O CH2PH SO2 CONHME O CH2PH SO2 CONHME O CH2PH SO2 CONHME SO2 CH2CH2PH SO2 NHMS SO2 CH2CH2PH SO2 NHMS SO2 CH2CH2PH SO2 OH SO2 Et SO OH SO2 Et SO	CH ₂ NHMe	0		
COOH SO Et S CONH2 SO IPT S CONHME SO NPT S CONHME SO NPT S CONHME SO NBU S NHMS SO IBU S NHCOME SO Ph S NO2 CH2Ph S CHO S CH2CH2Ph S SO2H S ME SO2 OH SO IPT SO2 COME O NPT SO2 COME O NPT SO2 COOH O NBU SO2 CONHME O Ph SO2 CONHME O CH2Ph SO2 CONHME O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 OH SO2 Et SO	CH ₂ Ph	SO	CH ₂ CH ₂ Ph	
CONH2 SO iPr S CONHMe SO nPr S CONHMe SO nPu S CONHMS SO nBu S NHMS SO tBu S NHCOME SO Ph S NO2 SO2 CH2Ph S CHO S CH2PH2Ph S SO3H S Me SO2 SO4H SO iPr SO2 COMH SO iPr SO2 COME O nBu SO2 CONH2 O tBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 Et SO OH SO2 Et SO OH SO2 IPr SO	COMe	so	Me	
CONHMe SO nPr S CONHMS SO nBu S NHMS SO nBu S NHMS SO tBu S NHCOME SO Ph S NO2 SO2 CH2Ph S CHO S CH2CH2Ph S SO3H S Me SO2 SO2NHME SO2 Et SO2 COME O nPr SO2 COME O nBu SO2 CONH2 O tBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 Et SO OH SO2 Et SO OH SO2 Et SO OH SO2 Et SO	COOH	SO	Et	
CONHMS SO nBu S NHMS SO tBu S NHMS SO tBu S NHCOME SO Ph S NO2 SO2 CH2Ph S CHO S CH2CH2Ph S SO3H S Me SO2 SO3HHME SO2 Et SO2 COME O nPr SO2 COME O nBu SO2 COOH O nBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHME O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 Et SO OH SO2 Et SO OH SO2 Et SO	CONH ₂	SO	iPr	
NI-IMS SO IBU S NHCOME SO Ph S NO2 CH2Ph S CHO S CH2CH2Ph S SO2H S Me SO2 OH SO IPr SO2 COME O nPr SO2 CONHO O nBU SO2 CONHO O Ph SO2 CONHO SO2 Et SO OH SO2 Et SO	CONHMe	SO	nPr	
NHCOMe	CONHMs		nBu	
NO2 SO2 CH2Ph S CHO S CH2CH2Ph S SO3H S Me SO2 SO2NHME SO2 Et SO2 OH SO IPr SO2 COME O nPr SO2 COOH O nBu SO2 CONH2 O IBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 OH SO2 Et SO OH SO2 Et SO COME SO2 IPr SO	NHMs	SO	tBu	
CHO S CH ₂ CH ₂ Ph S SO ₂ HMe SO ₂ Et SO ₂ OH SO IPr SO ₂ COME O nBu SO ₂ CONHME O Ph SO ₂ CONHMS SO ₂ CH ₂ CH ₂ Ph SO ₂ CONHMS SO ₂ CH ₂ CH ₂ Ph SO ₂ CONHMS SO ₂ CH ₂ CH ₂ Ph SO ₂ CONHMS SO ₂ CH ₂ CH ₂ Ph SO ₂ SO ₂ Me SO OH SO ₂ Et SO COME SO ₂ IPr SO	NHCOMe	SO		
SO3H S Me SO2	NO ₂	SO ₂	CH ₂ Ph	
SO2/NHMe SO2/SO2/NHMe Et SO2/SO2/NHMe OH SO iPr SO2 COME O nPr SO2 COOH O nBu SO2 CONH2 O tBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NO2 SO2 Me SO OH SO2 Et SO COME SO2 iPr SO	CHO		CH ₂ CH ₂ Ph	_
OH SO IPT SO2 COME O nPT SO2 COOH O nBu SO2 CONH2 O tBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NHMS SO2 EH2 SO OH SO2 Et SO COME SO2 IPT SO	SO₃H			
COMe O nPr SO2 COOH O nBu SO2 CONH2 O tBu SO2 CONHM6 O Ph SO2 CONHM8 O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NIO2 SO2 Me SO OH SO2 Et SO COMe SO2 IPr SO	SO ₂ NHMe		Et	
COOH O nBu SO2 CONH2 O tBu SO2 CONHME O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NO2 SO2 Me SO OH SO2 Et SO COME SO2 IPr SO	OH	so	íPr	
CONH2 O tBu SO2 CONHMe O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NIMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NO2 SO2 Me SO OH SO2 Et SO COMe SO2 iPr SO	COMe	0	nPr	
CONHMe O Ph SO2 CONHMS O CH2Ph SO2 NHMS SO2 CH2CH2Ph SO2 NO2 SO2 Me SO OH SO2 Et SO COMe SO2 IPr SO	COOH	0	nBu	
CONHMS O CH₂Ph SO₂ NHMS SO₂ CH₂CH₂Ph SO₂ NO₂ SO₂ Me SO OH SO₂ Et SO COMe SO₂ IPr SO	CONH ₂	0	tBu	
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	CONHMe	0	Ph	
NO_2 SO_2 Me SO OH SO_2 Et SO $COMe$ SO_2 Pr SO	CONHMs			
OH SO ₂ Et SO COMe SO ₂ iPr SO				
COMe SO ₂ iPr SO	NO ₂		Me	
	OH		Et	
COOH SO ₂ nPr SO	COMe		iPr	
	COOH	SO ₂	nPr	SO

【0184】 【表16】

R ¹³	Х	R ¹³	×
NO ₂	0	Мө	0
CHO	0	Et	0
SO ₃ H	0	iPr	0
a	0	nPr	0
Br	0	nBu	0
CH ₂ OH	0	tBu	0
CH ₂ NH ₂	0	Ph	0
CH₂NHMe	0	CH ₂ Ph	0
CH₂Ph	SO	CH ₂ CH ₂ Ph	0
COMe	SO	Me	S
COOH	SO	Et	S
CONH ₂	SO	iPr	S
CONHMe	SO	nPr	S
CONHMs	so	nBu	S
NHMs	so	tBu	S
NHCOMe	SO	₽h	S
NO ₂	SO ₂	CH₂Ph	S
CHO	S		S
so₃H	S	Me	SO ₂
SO ₂ NHMe	SO ₂	Et	SO ₂
ОН	so	iPr	SO ₂
COMe	0	nPr	SO ₂
COOH	0	nBu	SO ₂
CONH ₂	0	tBu	SO ₂
CONHMe	0	Ph	SO ₂
CONHMs	0	CH ₂ Ph	SO ₂
NHMs	SO ₂	CH ₂ CH ₂ Ph	SO ₂
NO_2	SO ₂	Me	SO
OH	SO ₂	Et	SO
COMe	SO_2	ıPr	so
COOH	SO ₂	nPr	SO

[0185]

【表17】 ю R¹³ R¹³ х х NO₂ CHO 0 00000000000000 Me Et SO₃H Ō iPr ci nPr Br nBu CH₂OH tBu CH2NH2 Ph CH₂NHMe CH₂Ph COMe CH₂Ph CH2CH2Ph Me Et COOH CONH₂ iPr CONHMe nPr S S S SO₂ SO₂ SO₂ SO₂ CONHMs nBu NHMs tBu NHCOMe Ph NO₂ CHO SO₃H SO₂NHMe OH CH₂Ph CH₂CH₂Ph Me S S SO₂ SO O O O SO₂ Εt iPr nPr COMe SO₂ SO₂ SO₂ COOH nBu CONH₂ tBu CONHMe SO₂ CONHMs CH₂Ph SO₂ SO₂ SO SO SO SO NHMs CH₂CH₂Ph NO₂ OH COMe COOH SO₂ Me SO₂ Εt SO₂ iPr nPr

【0186】 【表18】

HN-R			
HN	HN \	HN~	HN
HN~~	òн Г	HN^	, N
HN	HN		ни
HN	ни	HN	F HN
	HN	HN C	HN N
HN	NH NH	الحااا .	HN~S~
HN	HN ~	HN	HN~~O~
HN	ни	HN COOH	ни~о
HN	HNOH	F HN	HN
HN		HN NH2	HN
1		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	,n-J
HN OH	ни		HN~y?
HN	HN \	N OH	
[0	187]		

表19】

	~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~
K13	Me
R ¹¹	R ¹³
Н	Et
Н	iPr
н	nPr
Н	nBu
н	t⊟u
Me	Ph
Me	NO ₂
Me	CHO
Me	SO₃H
Me	CI
Me	Br
Et	CH ₂ OH
Et	CH ₂ NH ₂
Et	CH ₂ NHMe
í₽r	CH₂Ph
nPr	COMe
nBu	COOH
tBu	CONH ₂
Ph	CONHMe
CH ₂ OH	CONHMs
CH ₂ OH	NHMs
CH ₂ OMe	NHCOMe
CH ₂ OMe	NO ₂
CH ₂ NH ₂	CHO
CH ₂ NH ₂	nPr
CH ₂ NH ₂	CI
CH ₂ NH ₂	F
CH ₂ NHMe	CI
CH ₂ Ph	Et
CH ₂ Ph	nPr
CH ₂ CH ₂ Fh	Ph

【0188】

R¹¹ HIN OH Me

\mathbb{R}^{13}	Me
R ¹¹	R ¹³
н	Et
н	iPr
н	nPr
н	nBu
н	tBu
Me	Ph
Me	NO ₂
Me	CHO
Me	SO₃H
Me	a
Me	Br
Et	CH ₂ OH
Et	CH ₂ NH ₂
Et	CH₂NHMe
íPr	CH ₂ Ph
nPr	COMe
nBu	COOH
tBu	CONH ₂
Ph	CONHMe
CH ₂ OH	CONHMs
CH ₂ OH	NHMs
CH ₂ OMe	NHCOMe
CH ₂ OMe	NO ₂
CH ₂ NH ₂	CHO
CH_2NH_2	nPr
CH ₂ NH ₂	CI
CH ₂ NH ₂	F
CH₂NHMe	a
CH₂Ph	Et
CH₂Ph	nPr
CH2CH2Ph	Ph

[0189]

	【表 2	1]
R ¹¹ H	m^~	
Ň	Д он	
I L'M	-Me	
T/13	O'Me	
	42	
R ¹¹	R ¹³	
Н	Et .	
н	1Pr	
Н	nPr	
н	nBu	
Н	tBu	
Me	Ph	
Me	NO ₂	
Me	CHO	
Me	SO₃H	
Me	a	
Me	Br	
Et	CH ₂ OH	
Et	CH ₂ NH ₂	
Et 'E-	CH ₂ NHMe	
iPr	CH₂Ph	
nPr	COMe	
nBu *Bu	COOH	
tBu Ph	CONH ₂	
CH ₂ OH	CONHMs CONHMs	
CH ₂ OH	NHMs	
CH ₂ OMe	NHCOMe	
CH ₂ OMe	NO ₂	
CH ₂ NH ₂	CHO	
CH ₂ NH ₂	nPr	
CH ₂ NH ₂	ci	
CH ₂ NH ₂	F	
CH₂NHMe	a	
CH ₂ Ph	Et	
CH ₂ Ph	nPr	
CH₂CH₂Ph	₽h	

[0190] 【表22】

он -Me Me R¹¹ R¹³ Н Et HHHH íPr nPr nBu tBu Me Me NO₂ Me Me Me Me Et Et CHŌ SO₃H Cl Br CH₂OH CH₂NH₂ CH₂NHMe Εt CĤ₂Ph nPr COMe nBu COOH CONH₂ tBu Ph CH₂OH CONHMs CH₂OH CH₂OMe CH₂OMe CH₂NH₂ CH₂NH₂ NHMs NHCOMe

[0191]

NO₂ CHO nPr CI F

ci Et

nPr Ph

CH₂NH₂ CH₂NHMe

CH₂Ph

CH₂Ph CH2CH2Ph

HN HN OH HN HN N HN N HN N HN N HN N HN	HN-R			
HN HN F HN F HN S	N~~ H	IN T	ни	ни
HN HN F HN S HN S			HN \	
HN HN S HN	" 🗘	F	11 .1	
HN S		C		
HN HN COOH HN O HN O HN O HN O HN O HN O				
HN COOH HN OH HN NH2 HN NH HN NH2 HN NH HN NH2 HN NH HN NH HN NH		HN F.	HN T	HN~~°
HN OH HN NH2 HN HN HN HN NH			соон	HN~°C
HN HN HN HN N		HN	un C	HN
HN HN N HN N N N N N N N N N N N N N N	\bigcap		HN~	HN N
HN HN N	1	ö	HŇ Me	. n/ />CI
		š 🎧	HN	HN N
HN HN N OH	óн in	. ' 🕥	N	g

【0192】 【表24】

HN-R			
HN ~	HN \	ни	HN
HN	óн	HN C	HN N
HN	HN F	HN \	
HN	HN	HN \	F HN
HN	HN NH	, ,	HN N
HN	HN	2 HN F	HN
HN \	HN	HN COOH	HN~O
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN J	HN HN Me	HN
HN	HN S	HN HN	HN N CI
HN OH	HN		LN NH
HN T	ни	N OH	

【表25】

HN-R			
HN	TIM T	ни	HN N
HN	óн	ни	
HN	HN F	HN~~	···
HN	HN	HN \	F HN N
HN	HN	√√ _F	HN N
	HN NH	2 HN	HN~S
HN	F_	HN \	HN O
HN (HN	соон	N N
HN	HN OH	HN NH ₂	HN
HN	HN T	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
ı	HN	HN	HN N
HN OH	HN		, B
	HN	он	

【0194】 【表26】

HN-R			
HN	HN \	ни	HN N
HN	он	HN	HN ON O
HN	HN F	HN~~	····
HN	HN CI	HN	F HN N
HN \	HN	Ų√, ^	HN N
\cap	HN	HN F	HN ~ ~ 0.
HN	F	HN ~	HN O
HN	HN	соон F	_N_
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	ни	HN
HN -		HN Me	HN N CI
1	HN	HN	HN N
HN OH	HN	N	8
B		он	

HN-R			
ни	HN OH	HN	HN
HN	ни	HN	HN N N
HN	F	ни	, ,
ни	HN	HN	F HN
HN	HN	√_F	HN S
HN	ни	HN	HN ~~ 0 ~
HN \	HN O	ни соон	HN~O
HN	HN	F HN	HN
\bigcap	óн	HN NH2	HN
HN	HN	HN Me	N= N → CI
HN	HN	HN	N
HN OH	HN		HN N
HN	ни	N OH	

【0196】 【表28】

HN-R			
HN ~~	HN OH	ни	HN
HN	ни	HN	HN N N
HN	F	HN~~	,
HN	HN	HN~	F HN
HN \	HN	, (°)	HN S
HN	HN	+N +	HN~~0~
HN \	HN	HN COOH	HN~°
	HN	HN \	HN
HN~~	ο OH	NH ₂	
HN	HN	HN HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	HN
ни	HN		HN~NA
ни	HN \	N OH	

HN-R			
ни	HN OH	ни	ни
HN ·	HN	HN O	
HN	HN F	HN~~	o N
ни	ام	HN C	HN
HN	HN		HN S
HN	HN F	HN	HN~~°
HN	HN	HN COOH	HN~°
HN	ни	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN	HN
HN .		HN-Me	HN N CI
HN	HN	HN	HN N
ни Он	ни	N OH	O

HN-R			
HN~	HN OH	ни	HN
HN	HN	HN	HN N N
HN	F	ни	
HN	HN	HN	-F HN ~~N ~
HN	ни	V√F	HN N
\cap	HN	HN F	HN O
HN	HN F	HN ~	HN~~°
HN		соон F	N _N
HN ()	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN	HN
ни		HN Me	HN N CI
	HN	HN	L'N NH
HN OH	HN		<i>R</i>
		он	

		【表 3	1]
		ľ	$\widehat{}$
	R ¹¹	·/~~/n	"
	Ň-	Д он	
0=	∢``I ``J	I_Me	
	Й	O Me	
	R ¹²		_
	R ¹¹	R ¹²	
	Н	Me	-
	Н	Et	
	н	iPr	
	н	nPr	
	Н	nBu	
	Мө	tBu	
	Me	Ph	
	Me	CH ₂ OH	
	Me	CH ₂ OMe	
	Me	CH ₂ NH ₂	
	Me	Me	
	Et	CH ₂ NH ₂	
	Et Et	CH ₂ NHMe	
	Et IPr	CH₂Ph CH₂Ph	
	nPr	CH ₂ CH ₂ Ph	
	nBu	H	
	tBu	Me	
	Ph	Н	
	CH ₂ OH	Me	
	CH ₂ OH	Et	
	CH ₂ OMe	nPr	
	CH ₂ OMe	Ph	
		н	
	CH ₂ NH ₂	nPr	
	CH ₂ NH ₂	Ph	
	CH ₂ NH ₂	Me	
	CH ₂ NHMe	Εt	
	CH ₂ Ph	nPr	
	CH₂Ph	Ph	
	CH ₂ CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	_

【0200】 【表32】

[0201]

	【表 3	3]
\mathbf{R}^{11}	HN ^	<u> </u>
Ň~	Он	
0≼ ↓ ∫	_Me	
N	O Me	
R12		_
R ¹¹	R ¹²	
		-
н	Me	
н	Et	
Н	iPr	
Н	nPr	
н	nBu	
Me	tBu	
Me	Ph	
Me	CH ₂ OH	
Me	CH ₂ OMe	
Me	CH ₂ NH ₂	
Me	Me	
Et	CH ₂ NH ₂	
Et	CH ₂ NHMe	
Et	CH ₂ Ph	
iPr	CH ₂ Ph	
nPr	CH ₂ CH ₂ Ph	
nBu	Н	
tBu	Me	
Ph	н	
CH ₂ OH	Me	
CH ₂ OH	Εt	
CH ₂ OMe		
CH ₂ OMe		
CH ₂ NH ₂	н	
CH ₂ NH ₂		
CH ₂ NH ₂		
CH ₂ NH ₂		
CH ₂ NHM		
CH ₂ Ph	nPr	
CH₂Ph	Ph	
CH ₂ CH ₂ P	h CH ₂ Ph	_
	0 2 0	9

【0202】 【表34】

[0203]

CH₂CH₂Ph

【表35】

HN-R			
HN	HN OH	HN~	ни
HN	HN	HN	HN
HN \	HN	HN~	E HN
ни		HN C	HN
HN	HN NH		HN~~S~
HN	HN F	HN	HN~~~
HN	HN	HN COOH	HN~O
HN	HN OH	HN NH ₂	HN
HN	HN ~	HN	HN
HN —	HN J	HN Me	HN N CI
HN \	HN N	HN	HN N
HN OH	HN	N OH	Ö
<u> </u>	0.04	011	

【0204】 【表36】

R ¹¹	R ¹³	-	R ¹¹	R ¹³		
Н	Me	-	Н	NO ₂		
н	Et		Н	CHO		
Н	ı₽r		Н	SO₃H		
н	n₽r		H	a		
н	nBu		Н	Br		
н	tBu		Me	CH ₂ OH		
н	Ph		Me	CH_2NH_2		
Me	Me		Me	CH ₂ NHMe		
Me	Εt		Me	CH ₂ Ph		
Et	iPr		Me	COMe		
Et	nPr		Me	COOH		
iPr	nBu		Et	CONH ₂		
nPr	tBu		Et	CONHMe		
nBu	Ph		Et	CONHMs		
tBu	i₽r		i Pr	NHMs		
₽ħ	nPr		nPr	NHCOMe		
CH ₂ OH	nBu		nBu	NO_2		
CH ₂ OH	tBu		tBu	CHO		
CH ₂ OMe	Ph		Ph	SO₃H		
CH ₂ OMe	Et		CH ₂ OH	SO ₂ NHMe		
CH ₂ NH ₂	nPr		CH ₂ OH	он		
CH2NH2	₽h	1	CH ₂ OMe	COMe		
CH ₂ NH ₂	a		CH ₂ OMe	COOH		
CH_2NH_2	F		CH ₂ NH ₂	CONH ₂		
CH ₂ NHMe	a		CH ₂ NH ₂	CONHMe		
CH ₂ Ph	Et		CH ₂ NH ₂	CONHMs		
CH ₂ Ph	nPr		CH_2NH_2	NHMs		
CH₂Pħ	Ph	(CH ₂ NHMe	NO ₂		
CH ₂ CH ₂ Ph	Me		CH ₂ Ph	он		
Н	CH ₂ Ph		CH ₂ Ph	COMe		
Me	CH ₂ Ph	C	CH ₂ CH ₂ Ph	COOH		

[0205]

R ¹¹ R ¹³ R ¹¹ R ¹³ H Me H NO ₂ H Et H CHO H IPr H SO ₃ H H nPr H CI H nBu H Br H tBu Me CH ₂ OH H Ph Me CH ₂ NHMe Me Me Me CH ₂ NHMe Me Et Me COMe Et nPr Me COMH IPr nBu Et CONHM3 nPr tBu Et CONHM3 nBu Ph Et CONHM8 nBu IPr IPr NHCOMe CH ₂ OH nBu nBu NO ₂ CH ₂ OH tBu tBu CHO CH ₂ OH OH CH ₂ OMe COME CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OMe COME CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OMe COME CH ₂ NH ₂ CONHM6 CH ₂ NH ₂ C CH ₂ NHMe CH ₂ Ph NPr CH ₂ OMe COME CH ₂ NHMe CH CH ₂ NHMe CH CH ₂ NHMe COMH CH ₂ NHMe CH CH ₂ NHMe COMH CH ₂ NHME CH CH ₂ NHME CH CH ₂ NHME CH CH ₂ Ph NPR CH ₂ Ph OH CH ₂ Ph NPR CH ₂ Ph OH CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph OH CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph COMH COME CH ₂ Ph CH CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH ₂ Ph CH CH ₂ Ph CH ₂				1416	
H Et H CHO H iPr H SO ₃ H H nPr H CI H nBu H Br H tBu Me CH ₂ OH H Ph Me CH ₂ NH ₂ Me Me Me Me CH ₂ NH ₂ Me Me CH ₂ NHMe Me Et Me CH ₂ Ph Et iPr Me COMH IPr nBu Et CONHMS nBu Ph Et CONHMS 1Bu iPr iPr NHMS Ph nPr nPr NHCOME CH ₂ OH tBu tBu CHO CH ₂ OH Bu tBu CHO CH ₂ OH Et CH ₂ OH CH	R ¹¹	R ¹³		R ¹¹	R ¹³
H IPT H SO3H H nPT H CI H nBU H Br H tBU Me CH2NH2 Me Me Me CH2NH1 Me Me CH2NH1 Me Me CH2NH2 Me Me CH2NH1 Me CH2NH1 Me Me CH2NH1 Me Me CH2NH1 Me CH2Ph Me COMe Me Et Me COME Me Et Me CONH2 Me Et IPT Me COME Me Et IPT Me COME Me TO ME ME TO ME ME CONHMS ME TO ME ME CH2OH DO ME ME CH2OH OH ME CH2NH2 CONH ME CH2NH2 CONH ME CH2NH2 CONH ME CH2NH3 CONHMS ME CH2PH ET CH2NH3 NHMS ME CH2PH TO ME ME CH2PH OH ME CH2PH ME CH2PH OH ME CH2PH	Н	Me	_	Н	NO ₂
H	Н	Et		Н	CHO
H nBu H Br H tBu Me CH ₂ OH H Ph Me CH ₂ NH ₂ Me Me CH ₂ NH ₂ Me Me Me CH ₂ NHMe Me Et Me CH ₂ NHMe Me Et Me CH ₂ NHMe Et nPr Me COMe Et nPr Me COOH IPr nBu Et CONHMe nPr tBu Et CONHMS tBu IPr IPr NHMS Ph nPr nPr NHCOMe CH ₂ OH nBu nBu NO ₂ CH ₂ OH tBu tBu CHO CH ₂ OMe Et CH ₂ OH OH CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ OM COMe CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OM COMe CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OM COME CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OM COME CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OM COME CH ₂ NH ₂ CONHME CH ₂ NHME CI CH ₂ NH ₂ CONHMS CH ₂ Ph Et CH ₂ NH ₂ CONHMS CH ₂ Ph Et CH ₂ NH ₂ NHMS CH ₂ Ph Ph CH ₂ NHME NO ₂ CH ₂ Ph Ph CH ₂ NHME NO ₂ CH ₂ Ph Ph CH ₂ NHME NO ₂ CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph OH CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH	Н	iPr		Н	SO₃H
H tBu Me CH ₂ OH H Ph Me CH ₂ NH ₂ Me Me Me Me CH ₂ NHMe Me Et Me CH ₂ NHMe Me Et Me CH ₂ Ph Et IPr Me COME Et nPr Me COOH IPr nBu Et CONIH ₂ nPr tBu Et CONIHMS tBu IPr IPr NHMS Ph nPr nPr NHCOME CH ₂ OH nBu nBu NO ₂ CH ₂ OH tBu tBu CHO CH ₂ OME Et CH ₂ OH OH CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OME CH ₂ NH ₂ CONIHME CH ₂ NH ₃ CONIHME CH ₂ NH ₄ CONIHME CH ₂ NH ₄ CONIHME CH ₂ NH ₄ CONIHME CH ₂ NH ₂ CONIHME CH ₂ NH ₃ CONIHME CH ₂ Ph Et CH ₂ NH ₂ CONIHMS CH ₂ Ph Et CH ₂ NH ₂ CONIHMS CH ₂ Ph Et CH ₂ NH ₂ CONIHMS CH ₂ Ph Ph CH ₂ NHME OH CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph OH CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph OH CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph OH	Н	nPr		Н	a
H Ph Me CH₂NH₂ Me Me Me Me CH₂NHMe Me Et Me CH₂NHMe Me Et Me CH₂NHMe Et IPr Me COMe Et nPr Me COOH IPr nBu Et CONHM₂ nPr tBu Et CONHMs tBu IPr IPr NHMS Ph nPr NHCOMe CH₂OH nBu nBu NO₂ CH₂OH tBu tBu CHO CH₂OMe Ph Ph SO₃H CH₂OMe Et CH₂OH OH CH₂NH₂ Ph CH₂OMe CH₂NH₂ Ph CH₂OMe CH₂NH₂ CH CH₂OMe CH₂NH₂ CH CH₂OME CH₂NH₂ CH CH₂OME CH₂NH□ CH₂NH₂ CONHMS CH₂Ph Et CH₂NH₂ CONHMS CH₂Ph Et CH₂NH₂ NHMS CH₂Ph Ph CH₂NHЫ NO₂ CH₂Ph Ph CH₂NHЫ NO₂ CH₂Ph Ph CH₂NHЫ NO₂ CH₂Ph Ph CH₂NHЫ NO₂ CH₂Ph Ph CH₂Ph OH CH₂Ph Ph CH₂Ph OH CH₂Ph Ph CH₂Ph OH CH₂Ph Ph CH₂Ph OH CH₂Ph Me CH₂Ph OH CH₂Ph CH₂Ph CH₂Ph OH CH₂Ph Me CH₂Ph OH CH₂Ph CH₂Ph OH CH₂Ph CH₂Ph OH CH₂Ph CH₂Ph OH	н	nBu		Н	Br
Me Me Me CH₂NHMe Me Et Me CH₂Ph Et IPr Me COMe Et IPr Me COOH IPr nBu Et CONHMe IPr nBu Et CONHMe nBu Ph Et CONHMe Bu IPr IPr NHMS Ph nPr NPCOME NP CH2OH nBu nBu NO2 CH2OH Ph Ph SO3H CH2OH Ph Ph SO3H CH2OME Ph Ph SO3H CH2OME Ph CH2OME COME CH2NH2 nPr CH2OME COME CH2NH2 Ph CH2OME COME CH2NH2 Ph CH2OME COME CH2NH2 Ph CH2OME COME CH2NH2 CONHME CH2NH2 CONHME CH2NH3		tBu		Me	
Me Et Me CH₂Ph Et IPr Me COMe Et IPr Me COOH IPr nBu Et CONHMe nPr tBu Et CONHMe nBu Ph Et CONHMe tBu iPr IPr NHMs Ph nPr nPr NHCOMe CH2OH nBu nBu NO2 CH2OH tBu tBu CHO CH2OH Ph Ph SO3H CH2OH Ph Ph SO2NHMe CH2NH2 nPr CH2OH OMe CH2NH2 Ph CH2OMe COMe CH2NH2 Ph CH2OMe COMe CH2NH2 Ph CH2OMe COMe CH2NH2 Ph CH2OMe CONH CH2NH2 Ph CH2OMe CONH CH2NH2 CONHMe CH2NH2 CONHMe CH2N	н	₽h		Me	
Et IPr Me COMe Et nPr Me COOH IPr nBu Et CONH2 nPr tBu Et CONHMS nBu Ph Et CONHMS tBu IPr IPr NHMS Ph nPr nPr NHCOMe CH2OH nBu nBu NO2 CH2OH tBu tBu CHO CH2OME Et CH2OH OH CH2NH2 Ph CH2OME CH2NH2 Ph CH2OME CH2NH2 Ph CH2OME CH2NH2 Ph CH2OME CH2NH3 Ph CH2OME CH2NH3 Ph CH2OME CH2NH3 Ph CH2OME CH2NH3 Ph CH2NH3 CONHMS CH2Ph Et CH2NH2 CONHMS CH2Ph TP CH2NHME CONHMS CH2Ph TP CH2NHME NO2	Me	Me		Me	CH ₂ NHMe
Et nPr Me COOH IPr nBu Et CONH2 nPr tBu Et CONHM2 nPr tBu Et CONHM8 nBu Ph Et CONHM8 tBu iPr IPr NHMS Ph nPr NPr NHCOME CH2OH nBu nBu NO2 CH3OH tBu tBu CHO CH2OME Ph Ph SO3H CH2OME Et CH2OH SO2NHME CH2NH2 Ph CH2OME COME CH2NH2 Ph CH2OME COOH CH2NH2 F CH2OME COOH CH2NH4 F CH2NH2 CONHM8 CH2Ph Et CH2NH2 CONHM8 CH2Ph Et CH2NH2 NHMS CH2Ph Ph CH2NHME NO2 CH2Ph Ph CH2NHME NO2 CH2Ph Ph CH2NHME NO2 CH2Ph Ph CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COME	Me	Εt		Me	CH₂Ph
IPr nBu	Et	iPr		Me	
nPr tBu Et CONHMe nBu Ph Et CONHMs tBu iPr iPr NHMs Ph nPr nPr NHMs Ph nPr nPr NHCOMe CH2OH nBu nBu NO2 CH2OH tBu CHO CHO CH2OME Ph Ph SO3H CH2OME CHO OH OH CH2NH2 nPr CH2OH OMe CH2NH2 Ph CH2OMe COMe CH2NH2 CH COH CH CH2NH2 CH CHY COH CH2NH2 CH CHY CONH CH2Ph Et CH2NH2 CONHMS CH2Ph Et CH2NH2 CONHMS CH2Ph Et CH2NH2 NHMS CH2Ph Ph CH2NH2 NHMS CH2Ph Ph CH2Ph OH		nPr		Me	
NBU Ph Et CONHMS	iPr			Et	
tBu iPr iPr nPr nHMs Ph n Pr nPr NHCMWe CH2OH nBu nBu NO2 CH2OH tBu tBu CHO CH2OMe Ph Ph SO3H CH2OMe Et CH2OH SO2NHMe CH2NH2 nPr CH2OH OH CH2NH2 Ph CH2OMe COMe CH2NH2 Ph CH2OMe COOH CH2NH2 CH CH2OMe COOH CH2NH2 CH CH2NH2 CONHME CH2NHME CH CH2NH2 CONHMIS CH2Ph Et CH2NH2 CNHMIS CH2Ph Ph CH2NHME NO2 CH2Ph Ph CH2Ph OH CH2CH3Ph Me CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COMe	nPr	tBu		Εt	CONHMe
Ph nPr nPr NHCOMe CH₂OH nBu nBu NO₂ CH₂OH tBu tBu CH0 CH₂OMe Ph Ph SO₃H CH₂OMe Et CH₂OH OH CH₂NH₂ nPr CH₂OH OH CH₂NH₂ Ph CH₂OMe COMe CH₂NH₂ CI CH₂OMe CONH CH₂NH₂ CI CH₂OMe CONH CH₂NH₂ CI CH₂NH₂ CONHMe CH₂NH CI CH₂NH₂ CONHMe CH₂Ph Et CH₂NH₂ CONHMs CH₂Ph Ph CH₂NH₂ NHMs CH₂Ph Ph CH₂NH NO₂ CH₂Ph Me CH₂Ph OH H CH₂Ph CH₂Ph COMe	nBu	Ph		Et	
CH2OH nBu nBu NO2 CH2OH tBu tBu CHO CH2OME Ph Ph SO3H CH2OME Et CH2OH SO2NHME CH2NH2 nPr CH2OH OH CH2NH2 Ph CH2OME COME CH2NH2 F CH2NH2 CONH2 CH2NH1 F CH2NH2 CONH1 CH2NH1 F CH2NH2 CONH1 CH2Ph Et CH2NH2 CONHMS CH2Ph nPr CH2NH2 NHMS CH2Ph Ph CH2NHME NO2 CH2CH2Ph ME CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COME					
CH2OH tBu tBu CHO CH2OMe Ph Ph SO3H CH2OMe Et CH2OH SO2NHME CH2NH2 nPr CH2OH OH CH2NH2 Ph CH2OME COME CH2NH2 F CH2NH2 CONH2 CH2NH16 C CH2NH2 CONHME CH2Ph Et CH2NH2 NHM5 CH2Ph nPr CH2NH2 NHM5 CH2Ph Ph CH2NHME NO2 CH2CH2Ph ME CH2Ph NO2 CH2Ph ME CH2Ph OH CH2CH2Ph ME CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COME		nPr		nPr	
CH2OMe Ph Ph SO3H CH2OMe Et CH2OH SO2NHMe CH3NH2 nPr CH2OH OH CH2NH2 Ph CH2OMe COMe CH2NH2 CI CH2OMe COOH CH2NH2 F CH2NH2 CONHM2 CH2NHME CI CH2NH2 CONHME CH2Ph Et CH2NH2 CONHMS CH2Ph Ph CH2NH2 NHMS CH2Ph Ph CH2NHME NO2 CH2CH3Ph Me CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COME	CH ₂ OH			nBu	
CH2OMe Et CH2OH SO2NHMe CH2NH2 nPr CH2OH OH CH2NH2 Ph CH2OH COMe CH2NH2 CI CH2OMe COOH CH2NH2 F CH2NH2 CONHM2 CH3NHM6 CI CH2NH2 CONHM6 CH2Ph Et CH2NH2 CONHM8 CH2Ph Et CH2NH2 NHM5 CH2Ph nPr CH2NHM6 NO2 CH2Ph Ph CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COME					
CH₂NH₂ nPr CH₂OH OH CH₂NH₂ Ph CH₂OMe COMe CH₂NH₂ Cl CH₂OMe COOH CH₂NH₂ F CH₂NH₂ CONH₂ CH₂NHMe Cl CH₂NH₂ CONHMe CH₂Ph Et CH₂NH₂ CONHMs CH₂Ph nPr CH₂NH₂ NHMs CH₂Ph Ph CH₂NHMe NO₂ CH₂CH₂Ph Me CH₂Ph OH H CH₂Ph CH₂Ph COMe					•
CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ OMe COMe CH ₂ NH ₂ Cl CH ₂ OMe COOH CH ₂ NH ₂ F CH ₂ NH ₂ CONH ₂ CH ₂ NHMe Cl CH ₂ NH ₂ CONHMs CH ₂ Ph Et CH ₂ NH ₂ CONHMs CH ₂ Ph nPr CH ₂ NH ₂ NHMs CH ₂ Ph Ph CH ₂ NHMe NO ₂ CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH H CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMe					
CH2NH2 CI CH2OMe COOH CH2NH2 F CH2NH2 CONH2 CH2NHMe CI CH2NH2 CONHMe CH2Ph Et CH2NH2 CONHMS CH2Ph Pr CH2NH2 NHMS CH2Ph Ph CH2NHMe NO2 CH2CH2Ph Me CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COMe					
CH ₂ NH ₂ F CH ₂ NH ₂ CONH ₂ CH ₂ NHMe Cl CH ₂ NH ₂ CONHMe CH ₂ Ph Et CH ₂ NH ₂ CONHMs CH ₂ Ph nPr CH ₂ NH ₂ NHMs CH ₂ Ph Ph CH ₂ NHMe NO ₂ CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH H CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMe					
CH2NHMe CI CH2NH2 CONHMe CH2Ph Et CH2NH2 CONHMS CH2Ph nPr CH2NH2 NHMS CH2Ph Ph CH2NHMe NO2 CH2CH2Ph Me CH2Ph OH H CH2Ph CH2Ph COMe					
CH₂Ph Et CH₂NH₂ CONHMS CH₂Ph nPr CH₂NH₂ NHMS CH₂Ph Ph CH₂NHMe NO₂ CH₂CH₂Ph Me CH₂Ph OH H CH₂Ph CH₂Ph COMe					
CH ₂ Ph nPr CH ₂ NH ₂ NHMs CH ₂ Ph Ph CH ₂ NHMe NO ₂ CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH H CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMe	-				
CH ₂ Ph Ph CH ₂ ÑHMe NO2 CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH H CH ₂ Fh CH ₂ Ph COMe					
CH ₂ CH ₂ Ph Me CH ₂ Ph OH H CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMe	-				
H CH ₂ Ph CH ₂ Ph COMe					
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·					
Me CHaPh CHaCHaPh COOH	• • •			-	
- Origona in door	Me	CH ₂ Ph	_ 0	H ₂ CH ₂ Ph	COOH

【0206】 【表38】

R ¹¹	R ¹³		R ¹¹	R ¹³
Н	Me	_	Н	NO ₂
н	Εt		Н	CHO
н	iPr		Н	SO₃H
н	nPr		Н	a
H	nBu		Н	Br
Н	tBu		Me	CH₂OH
н	Ph		Me	CH ₂ NH ₂
Me	Me		Me	CH ₂ NHMe
Me	Εt		Me	CH ₂ Ph
Et	i₽r		Me	COMe
Et	nPr		Me	COOH
ìPr	nBu		Εt	CONH ₂
nPr	tBu		Εt	CONHMe
nBu	₽h		Et	CONHMs
tBu	íPr		iPr	NHMs
Ph	nPr		nPr	NHCOMe
CH ₂ OH	nBu		nBu	NO ₂
CH ₂ OH	tBu		tBu	CHO
CH ₂ OMe	₽h		Ph	SO₃H
CH ₂ OMe	Εt		CH ₂ OH	SO ₂ NHMe
CH ₂ NH ₂	nPr		CH ₂ OH	он
CH ₂ NH ₂	Ph		CH₂OMe	COMe
CH2NH2	CI		CH₂OMe	COOH
CH ₂ NH ₂	F		CH ₂ NH ₂	CONH ₂
CH ₂ NHMe	а		CH ₂ NH ₂	CONHMe
CH₂Ph	Εt		CH ₂ NH ₂	CONHMs
CH ₂ Ph	nPr		CH ₂ NH ₂	NHMs
CH₂Ph	Ph	(CH ₂ NHMe	NO ₂
CH ₂ CH ₂ Ph	Me		CH ₂ Ph	OH
H	CH ₂ Ph		CH ₂ Ph	COMe
Me	CH ₂ Ph	_ (CH ₂ CH ₂ Ph	СООН
	^ ^	^	T	

[0207]

【表39】

R ¹¹	R ¹³	_	R ¹¹	R ¹³
Н	Me	-	Н	NO ₂
н	Εt		Н	CHO
н	ıPr		н	SO₃H
н	nPr		Н	Cl
Н	nBu		Н	Br
н	tBu		Mə	CH ₂ OH
н	₽h		Me	CH ₂ NH ₂
Me	Me		Me	CH ₂ NHMe
Me	Εt		Me	CH ₂ Ph
Et	iPr		Me	COMe
Et	nPr		Me	COOH
iPr	nBu		Et	CONH ₂
nPr	tBu		Εt	CONHMe
nBu	₽h		Et	CONHMs
tBu	iPr		iPr	NHMs
Ph	nPr		nPr	NHCOMe
CH ₂ OH	nBu		nBu	NO ₂
CH ₂ OH	tBu		tBu	CHO
CH ₂ OMe	₽ħ		Ph	SO₃H
CH ₂ OMe	Εt		CH ₂ OH	SO ₂ NHMe
CH ₂ NH ₂	nPr		CH ₂ OH	он
CH ₂ NH ₂	₽h	(CH ₂ OMe	COMe
CH2NH2	a	(CH ₂ OMe	COOH
CH2NH2	F	(CH ₂ NH ₂	CONH ₂
CH ₂ NHMe	Cl	(CH ₂ NH ₂	CONHMe
CH₂Ph	Εt	(CH ₂ NH ₂	CONHMs
CH₂Ph	nPr		CH ₂ NH ₂	NHMs
CH ₂ Ph	₽ħ		H ₂ NHMe	NO ₂
CH ₂ CH ₂ Ph	Me		CH ₂ Ph	OH
Н	CH ₂ Ph		CH ₂ Ph	COMe
Me	CH₂P'n	С	H ₂ CH ₂ Ph	COOH

【0208】 【表40】

HN-R			
HN~	HN OH	HN^\\	HN
HN	HN .	HN	HN
HN \	HN CI	HN \	F HN
HN	HN	HN F	HN N
HN	HN	HN F	HN
HN	HN	HN COOH	HN
HN \	HNOH	HN NH ₂	HN N
HN	HN	HN HN Me	HN N=
ни	HN	HN	HN N CI
HN OH	HN		HN N
ни	ни	N OH	

HN-R			
ни~	ни	HN~	HN N
HN	óн	HN	a Color
HN	HN		HN \\
HN	HN	HN	·F HN ~ N
\Box	HN	HN	HN N
HN ~	, M	HN -	HN~~S~
HN	HN F	[HN~~O~
HN \	HN	HN	HN
HN~	HN	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN HN	HN N CI
ни	HN		AN NA
ни	HN	N OH	

【0210】 【表42】

HN-R			
ни ~~	FIN [4N~~	HN N
ни		HN^\	
HN	HN F	HN~~	HN
HN	HN	HN \	F HN N
HN	HN		HN N
\sim	HN NH2	HN	HN ~ 5
HN	HN F	HN \	HN O
HN	, in	соон	
HN) HN OH	HN NH ₂	HN
HN) HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
ни	HN S	HN	N N
ни фн	HN	N	δ
<u> </u>	2111	он	

【表43】

HN-R			
HN~	HN OH	HN \	HN
ни		HN \	HN N N
HN	HN	HN~~	1
HN	HN	HN \	F HN \\O
HN	HN~	√√ _F	HN N
) HN	HN F	HN O
HN	, HN F	HN	HN~O
HN~~		соон F	
HN ~	HNOH	HN NH ₂	HN ~
HN ~) HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN \	HN N D-CI
ни	HN S		The will
ни Он	HN	N OH	-
<u> </u>	2121		

【0212】 【表44】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	,	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	Н	NO ₂	н		Н	н	NO ₂
н	H	iPr	H	CHO	Н		H	Н	CHO
н	Н	nPr	н	so₃H	н		Н	Н	so₃H
н	н	nBu	н	a	н		Н	Н	CI
н	н	tBu	н	Br	Н		H	Н	Br
Me	H	H	Me	CH ₂ OH	Н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	t₿u	Н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Εt	CONH ₂	н		Et	н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et		Et	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
ıPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		íPr	n₽r	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂ H
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	a	Et	Ph	so₃H	Et		Ph	Et	H
CH2OH	C1	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	Cl		CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	Cl		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	H	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et			Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr			nPr	Н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph			Ph	н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	С	H ₂ NHMe	Me	H
CH₂Ph	Æt	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Εt	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	С	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
	(0	$\overline{2}$ 1	3				,		

H H Et H NO2 H H H NO H										
H	R ¹¹	R ¹³	R ^{1 4}	R ¹¹	R ¹³	R14	•	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
H H IPr H CHO H H H CO H H H H CO H CH2OH H H H CO H CH2OH H ME CH2OH H ME H CH2OH H ME CO H ME H	н	н	Et	Н	NO ₂	н		н	Н	NO ₂
H H nPr H SO ₃ H H H H SS H H H nBu H Cl H H H H Me H H Me CH ₂ OH H Me H CH Me Et Ph Me CH ₂ NH ₂ H Me H CH Me nPr H Me CH ₂ NH H Me H CH Me nPr H Me CH ₂ NH H Me H CH Me nBu H Me COOH H Me H CH Me nBu H Me COOH H Me H CC Et Ph H Et CONH Et Et Et CO IPr H nPr iPr NHMs iPr Et IPr CO IPr H nBu nPr NHCOMe nBu nPr nPr nPr NH NBu H Bu NO ₂ tBu nBu NPr nPr nBu H Bu NH Ph CH ₂ OH SO ₂ NMe nPr CH ₂ OH NPr CH ₂ OH Ph CH ₂ OH CI nPr CH ₂ OH SO ₂ NMe nPr CH ₂ OH Ph CH ₂ OH CI CH ₂ OH COH CI CH ₂ OMe CI CH ₂ OMe CI CH ₂ OMe Et CI CH ₂ OMe CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHMS ET CH ₂ NH ₂ CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHMB ET CH ₂ NH ₂ CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHMB ET CH ₂ NH ₂ CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHMB ET CH ₂ NH ₂ CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHMB ET CH ₂ NH ₂ ET CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHMB ET CH ₂ NH ₂ ET CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHMS PP CH ₂ NH ₂ ET CH ₂ NH ₂ H ET CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ NHMS PP CH ₂ NH ₂ Ph		н	iPr			н			Н	CHO
H H H nBu H CI H H H H H H 18u H Br H H H H Me H CH2NH2 H Me H CH Me Et Ph Me CH2NH2 H Me H CH Me nPr H Me CH2NHME H Me H CH Me nBu H Me COME H Me H CH Me nBu H Me COOH H Me H CO Me nBu H Me COOH H Me H CO Me tBu H Me COOH H Me H CO Et Ph H Et CONH2 H Et Et Et CO Et H IPr Et CONH3 IPr Et IPr OO IPr H nBu nPr NHCOME nBu nPr nBu NH nBu H tBu nBu NO2 tBu nBu nPr nBu NH nBu H tBu nBu NO2 tBu nBu nPr nBu NH nBu H TBu nBu CHO Ph TBu Ph Ph CI Et Ph SO3HME TP ET Ph Et CH2OME CI CH2OME COME CI CH2OME CI CH2OME CI CH2OME COOH CI CH2OME CI CH2NH2 H Et CH3NH2 CONHME ET CH3NH2 CI CH2NH2 H ET CH3NH2 CONHME ET CH3NH2 CI CH2NH2 H ET CH3NH2 CONHME ET CH2NH2 ET		Н	nPr	н	SOaH	н				SO₃H
H H IBU H Br H H H CH Me H H H Me CH ₂ NH ₂ H Me H CH Me IPr H Me CH ₂ NH ₂ H Me H CH Me nPr H Me CH ₂ NHMe H Me H CH Me nPr H Me CH ₂ NHMe H Me H CH Me nBu H Me COOH H Me H CH Et Ph H Et CONHMe Et Et Et CO Et H IPr Et CONHMe IPr NH IPr H nBu nPr NH IBu H Bu NO ₂ IBu nBu nBu NH IBu H Ph IBu CHO Ph IBu Ph Ph CI Et Ph SO ₃ M Et Ph ET CH ₂ OM CI CH ₂ OM Et CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Et CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph Et CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph Et CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OM Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OH CI Ph CH ₂ OH COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OH CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OH Ph CI CH ₂ OM COOH CI CH ₂ OM CI CH ₂ OH Ph CH		н	nBu	Н	ci	Н				Cl
Me Et Ph Me CH₂NH₂ H Me H CH₂ Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH Me nPr H Me CH₂Ph H Me H CH Me nBu H Me COMe H Me H CO Me tBu H Me COOH H Me H CO Et Ph H Et COOH H Me H CO Et Ph H Et Et Et Et Et CO CO H H CO CO H L CO CO D N D CO D N D CO N D N D N N N N N N N N N N N N N	н	н	tBu	н	Br	н				Br
Me IPr H Me CH ₂ NH ₂ Me H Me H CH ₂ NH ₂ Me nPr H Me CH ₂ Ph H Me H CH ₂ Ph H Me H CO COMe H Me H CO COMe H Me H CO CO NH NH CO CO NH	Me	Н	н	Me	CH ₂ OH	н				CH ₂ OH
Me nPr H Me CH₂Ph H Me H CO Me nBu H Me COMe H Me H CO H Me H CO H Me H CO CO H Bu H CO CO ND	Me	Εt	Ph	Me						CH ₂ NH ₂
Me nBu H Me COMe H Me H COMe Me tBu H Me COOH H Me H CO Et Ph H Et CONH H Et H CO Et Ph H Et Et Et Et H CO Et H iPr Et CONHMS iPr Et IPr CO Et H iPr Et CONHMS iPr Et IPr CO iPr H nBu nPr iPr iBu nPr nPr NP NP NP nBu NP nBu NP nBu NP nBu NP NB NP nBu NP NBu <t< td=""><td>Me</td><td>iPr</td><td>н</td><td>Me</td><td>CH₂NHMe</td><td></td><td></td><td></td><td></td><td>CH₂NHMe</td></t<>	Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe					CH ₂ NHMe
Me IBU H Me COOH H Me H CO Et Ph H Et CONH½ H Et H CO Et Ph H Et Et CONHMe Et Et Et Et Et Et CO CONHME Et Et Et Et CO CO CO PP Et Et Et CO PP IBU NP	Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	н				CH ₂ Ph
Et Ph H Et CONH ₂ H Et H CO Et H Et Et CONHMe Et Et Et CO IPr H nPr iPr NHMs nPr iPr nPr N nPr H nBu nPr NHCOMe nBu nPr nBu NH- nBu H tBu nBu NO ₂ tBu nBu nBu NB- tBu H Ph tBu CHO Ph tBu Ph Ph Cl Et Ph SO ₃ H Et Ph Et CH ₂ OH Cl nPr CH ₂ OH OH Ph CH ₂ OH OH CH ₂ OH Cl CH ₂ OH Cl CH ₂ OH Cl CH ₂ OH CH ₂ OH Cl CH ₂ OH Cl CH ₂ OH Cl CH ₂ OH CH ₂ OH Cl CH ₂ OH Cl CH ₃ OH CO CO CH ₂ OH Cl CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl CH ₂ OH CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl CH ₃ OH Cl CH ₃ OH CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl COH Cl CH ₂ OH CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl COH Cl CH ₃ OH CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl COH Cl CH ₃ OH CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl COH Cl CH ₃ OH CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl COH Cl CH ₃ OH CH ₂ OH Cl CH ₃ OH Cl COH Cl CH ₃ NH CH ₃ OH Cl CH CH ₃ NH CH ₃ OH Cl CH CH ₃ NH CH ₃ OH Cl CH	Me	nBu	Н	Me	COMe					COMe
Et H Et Et CONING Et Et Et CO C ET CONING ET ET ET CONING ET ET CONING ET ET ET CONING ET ET ET CONING ET ET CONING ET ET CONING ET ET CONING ET CH20H ET CH20H CONING ET CH20H CONING ET CH20H ET CH20H CONING ET CH20H ET CH20H ET CH20H CONING ET CH20H ET CH20H CONING ET CH20H ET CH20H ET CH20H CONING ET CH20H E	Me	tBu		Me	COOH					COOH
Et H iPr Et CONINNS IPr Et iPr CO IPP H nPr iPr NHMS nPr iPr nPr NH nPr H nBu nPr NHCOMe nBu nPr nBu NH nBu H tBu nBu NO2 tBu nBu nBu tBu N tBu H Ph tBu CHO Ph tBu Ph Ph Cl Et Ph SO3H Et Ph Et Ph Et CH2OH Cl nPr CH2OH OH Ph CH2OH nPr CH2OMe Cl CH2OMe COMe Cl CH2OMe Cl CH3OMe nPr Cl CH3OMe COOH Cl CH3OMe Cl CH3OMe nPr Cl CH3OMe COOH Cl CH3OMe Cl CH3NH2 CONINB TPR CH3NH2 H Et CH3NH2 CONINB ET CH3NH2 Cl CH2NH2 H Et CH3NH2 CONINB ET CH3NH2 Cl CH3NH3 H Ph CH3NH3 CONINB ET CH3NH3 PR	Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н				CONH ₂
Pr	Et	н	Et	Et	CONHMe	Et				CONHMe
NHCOME NBU NF NHCOME NBU NF NBU NF NBU N	Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr				CONHMs
No.	iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr				NHMs
Harmonia	nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe					NHCOMe
Ph CI Et Ph SO ₃ H Et Ph Et CH ₂ OH nPr CH ₂ OH nPr CH ₂ OH OH Ph CH ₂ OH OH Ph CH ₂ OH CI CH ₂ OMe Et CI CH ₂ OMe COH CI CH ₂ OMe CI CH ₂ OMe nPr CI CH ₂ OMe COOH CI CH ₂ OMe CI CH ₂ OH ₂ Ph CI CH ₂ OH ₂ CONH ₂ CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONHME Et CH ₂ NH ₂ CI CH ₂ NH ₂ H Et CH ₂ NH ₂ CONHME Et CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ CONHMS nPr CH ₂ NH ₂ Ph CH ₃ NH ₃ NHMS Ph CH ₂ NH ₂ Ph	nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂					NO₂H
CH2OH CI nPr CH2OH SO2NMe nPr CH2OH nPr CH2OH CI CH2OH CI CH2OH CI CH2OME COME CI CH2OME CI CH2O	tBu	н	Ph	tBu	CHO					Н
CH2OH CI Ph CH2OH OH Ph CH2OH Ph CH2OH Ph CH2OMe CI CH2OMe nPr CI CH2OMe COOH CI CH2OMe CI CH2NH2 Ph CI CH2NH2 Ph CI CH2NH2 COOHL2 CI CH2NH2 CI CH2NH2 Ph CI CH2NH2 CONHMB ET CH2NH2 ET CH2NH3 H PP CH2NH3 CONHMB Ph CH2NH3 PP	Ph	Cl		Ph	SO₃H					Н
CH2OH CI Ph CH2OH Ph CH2OH Ph CH2OMe Et CI CH2OMe COMe CI CH2OMe CI CH2OMe nPr CI CH2OMe COOH CI CH2OMe CI CH2NH2 Ph CI CH2NH2 CONH2 CI CH2NH2 CI CH2NH2 H Et CH2NH2 CONHMB Et CH2NH2 Et CH2NH2 H nPr CH2NH2 CONHMS nPr CH2NH2 nPr CH2NH3 H Ph CH3NH2 NHMS Ph CH2NH2 Ph	CH ₂ OH									н
CH2OME Et CI CH2OME COME CI CH2OME CI C		CI		CH ₂ OH						н
CH2OMe nPr CI CH2OMe COOH CI CH20Me CI CH2NH2 Ph CI CH2NH2 CONH2 CI CH2NH2 CI CH2NH2 H Et CH2NH2 CONHME Et CH2NH2 Et CH2NH2 H nPr CH2NH2 CONHMS nPr CH2NH2 nPr CH2NH3 H Ph CH3NH2 NHMS Ph CH2NH2 Ph		Et	CI	CH ₂ OMe						Cl
CH2NH2 H Et CH2NH2 CONHM8 Et CH2NH2 Et CH2NH4 H Pr CH2NH2 CONHM8 Pr CH2NH2 Pr CH2NH3 Pr CH2NH3 Pr CH2NH3 Ph CH2NH3 Ph		nPr		CH ₂ OMe						CI
CH ₂ NH ₂ H nPr CH ₂ NH ₂ CONHMS nPr CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ NH ₃ H Ph CH ₂ NH ₂ NHMS Ph CH ₂ NH ₂ Ph	CH ₂ NH ₂	Ph								CI
CH-NH ₂ H Ph CH ₂ NH ₂ NHMs Ph CH ₂ NH ₂ Ph	CH ₂ NH ₂									н
	CH2NH2									н
	CH ₂ NH ₂	Н								Н
CH2NHMe Me Me CH2NHMe NO2 Me CH2NHMe Me	H ₂ NHMe	Мe					С			H
CH ₂ Ph Et Et CH ₂ Ph OH Et CH ₂ Ph Et	CH₂Ph									н
CH₂Ph nPr nPr CH₂Ph COMe nPr CH₂Ph nPr	CH ₂ Ph						_			Н
CH ₂ CH ₂ Ph Ph Ph CH ₂ CH ₂ Ph COOH Ph CH ₂ CH ₂ Ph Ph	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	n COOH	Ph	Ç	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	н

【0214】 【表46】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14		R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	Н	Et	н	NO ₂	н		н	Н	NO ₂
н	Н	iPr	Н	CHŌ	н		Н	Н	CHO
н	Н	n₽r	н	\$O₃H	Н		Н	Н	so₃H
н	Н	nBu	н	ci	н		Н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH ₂ OH	Н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	íPr	н	Me	CH2NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	H	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Εt	Et	CONHMe	Εt		€t	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
n₽r	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO_2	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
₽h	Cl	Et	Ph	\$O₃H	Εt		Ph	Εt	Н
CH ₂ OH	a	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI		H ₂ OMe	Cl	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		H ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH ₂ NH ₂	Eŧ	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Мe		CH ₂ NHMe		Me	С	H ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt		CH ₂ Ph	Et	н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph		COOH	Ph	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	н

[0215]

【表47】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	Н	Et	н	NO ₂	н	н	Н	NO ₂
Н	Н	1Pr	н	CHO	н	н	Н	CHO
н	Н	nPr	н	SO ₃ H	н	н	Н	so₃H
Н	Н	nBu	н	ci	н	н	Н	CI
Н	Н	tBu	н	Br	н	н	н	Br
Me	н	н	Me	CH ₂ OH	Н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	₽h	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	ıPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Ме	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н	€t	н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	н	1Pr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
ιPr	Н	nPr	ıPr	NHMs	n₽r	ıPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nРr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	₽h	н
Ph	CI	Et	Ph	SO ₃ H	Εt	Ph	Et	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Εt	Ci	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	Cl	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH2NH2	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH2NH2	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Εt	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHM s	₽h	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH₂Ph	ОH	Εt	CH ₂ Ph	Εt	н
CH ₂ Ph	nPr	n₽r	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH₂CH₂PI	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н
	10	0 1	C					

【0216】

HN-R			
HN~	HN ~	HN \	HN N
HN	о́н . П	HN \	
HN	HN	HN \	HN
HN	HN CI		F HN
\Box	HN	HN	HN~\N
HN	NH	HN	HN~~S~
HN	HN F	(<u></u>	HN ~~ O~
HN	HN	HN COOH	HN O
HN	ни	HN \	HN
		HN TH2	HN
HN	HN	ни .ме	N=>-ci
HN	HN	ни	HN N
HNOH	HN		HN NY
HN	HN	N OH	

[0217]

【表49】

R ¹³ R ¹⁴ R ¹⁵ R ¹³ R ¹⁴ R ¹⁵ R ¹³ R ¹⁴ R ¹⁵ H H Et NO ₂ H Et H NO ₂ Et H H H Pr CHO Pr H Pr H CHO Pr H Pr H CONH Pr H Pr				10					
H H IPT CHO H IPT H CHO IPT H H H H NPT SO3H NPT H SO3H SO3H SO3H SO3H SO3H SO3H SO3H SO	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
H H nPr SO3H H nPr H SO3H nPr H H H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr NHMs H nPr NHMs H nPr H nPr H nPr H nPr H nPr NHMs H nPr NHMs H nPr NHMs H nPr N NHMs N NO2 H N NO2 H N NO3H N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	Н	н -	Et	NO ₂	н				
H H nBu CI H nBu H CI nBu H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	Н	Н	iPr	CHO	н	ίPr	н		ıPr
H H tiBu Br H tiBu H Br tiBu H H Br tiBu H H H CH ₂ OH Ph Et H H CH ₂ NH ₂ H H H CH ₂ NH ₃ N H H H COMP COMP H H COMP H H COMP COMP H H COMP COMP COMP H COMP COMP COMP COMP H COMP COMP COMP COMP COMP COMP COMP COMP	Н	Н	nPr	SO₃H	н	nPr			
H H Ph CH ₂ OH H Ph H CH ₂ OH Ph Et H CH ₂ NH ₂ H H H CH ₂ Ph H H COMe H H CH ₂ Ph H H COMe H H COMH ₂ H H COMH ₂ H H COMH ₂ H H Et H CONHMS IP H IP CONHMS H H IP COMHMS IP H IP CONHMS H H IP COMHMS IP H IP COMHMS H H IP COME II H IP COME II H II IN INCOME II H II IN INCOME II	Н	Н	nBu	а		nBu			
Et H H CH2NH2 H H H CH2NH2 H IPT H H CH2NHM6 H H H CH2NHM6 H NPT H H CH2NHM6 H H H H CH2NHM6 H NBU H H COM6 H H H H COM6 H IBU H H CONH H H H COM6 H Ph H H CONHM6 Et H H CONHM6 H H IPT H CONHM6 IPT H NPT NHM6 H H IPT H CONHM6 IPT H NP H NO2 H H IBU H NHCOM6 NBU H NBU NHCOM6 H H IBU H NHCOM6 NBU H NBU NHCOM6 H CI ET H SO3H ET H ET H SO3HM6 IPT H OH CI ET H SO3H ET H ET H OH CI Ph H OH Ph H Ph H OH ET COM6 IPT H OH COM6 IPT H NIMS NP I NHM6 IPT H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COM6 IPT	Н	н	tBu	Br					
Fig.	Н	H	Ph	CH ₂ OH					
nPr H H CH₂Ph H H H CH₂Ph H nBu H H H H H COMe H H H COMe H ph H H H COOH H H H COOH H ph H H COOH H H H COOH H H Et H COOH H H H COOH H H Et H COOH H H H COOH H H nPr H NHX H NHX H NHX H H nPr H NHX NHX H NH	Et [*]	н	Н	CH ₂ NH ₂	н				
nBu H H COMe H H H COMe H tBu H H H COOH H H H COOH H Ph H H H COOH H H H COOH H H Et H CONHMe Et H Et CONHMe H H IPr H CONHMe H IPr CONHMe H H IPr H NOOH IPR H IPR CONHME H H IPr H NIMS IPR H IPR IPR <td>iPr</td> <td>Н</td> <td>Н</td> <td>CH₂NHMe</td> <td>Н</td> <td></td> <td></td> <td>CH₂NHM</td> <td></td>	iPr	Н	Н	CH ₂ NHMe	Н			CH ₂ NHM	
18	nPr	н	н	CH ₂ Ph	н				
Ph H H CONH2 H H H CONH2 H H Et H CONHMe Et H Et CONHMe H H IPr H CONHMe H IPr CONHMe H H IPr H CONHME IPr H IPr CONHME H H nPr H NHMS NPr H nPr NHMS H H nBu H NHMS NPr H nBu NHCOME H H Bu H NHCOME H H Bu NHCOME H H Ph H CHO Ph H Ph H SO ₂ H H H Bu NHCOME H H H SO ₂ H H H Et H SO ₂ H H H Et H SO ₂ H H H Ph H <t< td=""><td>nBu</td><td>Н</td><td>Н</td><td>COMe</td><td>Н</td><td>Н</td><td></td><td></td><td></td></t<>	nBu	Н	Н	COMe	Н	Н			
H	tBu	Н	Н		н				
H IPr H CONI-IMS IPr H IPr CONI-IMS H H nPr H NHMS nPr H nPr NHMS H H nBu H NHCOME nBu H nBu NHCOME H H tBu H NO2 tBu H tBu NO2 H H Ph H CHO Ph H Ph H SO3H CI Et H SO3H Et H Et H SO2NI-IME CI nPr H SO2NI-IME nPr H nPr H OH Et CI H COME CI H CI CI COOH Et CI H CONI-2 CI H CI CI CONI-1/2 Ph CI H CONI-2 CI H CI CI CONI-1/2 H Et CI CONI-IMS nPr CI nPr H NI-IMS H nPr CI CONI-IMS nPr CI nPr H NI-IMS ME ME H NO2 ME H ME H OH Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COME NI-IMS NPR CI NPR H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COME NI-IMS NPR CI NPR COME NI-IMS NPR	Ph	н	H	CONH ₂	Н	Н	Н		
H	Н	Et	Н	CONHMe	Εt				
H nBu H NHCOMe nBu H nBu NHCOMe H H tBu H NO₂ tBu H tBu NO₂ H H Ph H CHO Ph H Ph H SO₃H CI Et H SO₃H Et H Et H SO₂NHME CI nPr H SO₃H Et H Et H SO₃NHME CI Ph H OH Ph H Ph H COME Et CI H COME CI Ph H COME CI H CI CI COOH nPr CI H CONH₂ CI H CI CI CONH₂ Ph CI H CONH₂ CI H CI CI CONHME H Et CI CONHME Et CI Et H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO₂ ME ME H NO₂ ME H ME H OH nPr nPr H COME The COME THE THE THE THE THE THE THE THE THE TH	Н	iPr	Н	CONHMs	i₽r				
H 189u H NO2 189u H 189u NO2 H H Ph H SO3H Et H Et H SO3H Et H Et H SO3H ET SON E	Н	nPr							
H Ph H CHO Ph H Ph H SO₃H CI Et H SO₃H Et H Et H SO₂NHMe CI nPr H SO₃NHMe nPr H nPr H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COMe Et CI H COMe CI H CI CI COOH nPr CI H CONH₂ CI H CI CI CONHM₂ Ph CI H CONH₂ CI H CI CI CONHMe H Et CI CONHME Et CI Et H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO₂ Me Me H NO₂ Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COMe nPr nPr H COME nPr H nPr H COME	Н	nBu	Н						
CI Et H SO3H Et H Et H SO2NHME CI nPr H SO2NHME nPr H nPr H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COME Et CI H COME CI H CI CI CONH2 NPr CI H CONH CI H CI CI CONHME H Et CI CONHME Et CI Et H CONHME H NPr CI CONHME Et CI ET H CONHME H Ph CI NHMS NPr CI nPr H NIMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 Me Me H NO2 Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COME NPr NPr H COME NPr H NPr H COME	Н	tBu	Н	NO ₂					
CI	Н	Ph	Н	CHO					
CI Ph H OH Ph H Ph H COMe Et CI H COMe CI H CI CI COOH nPr CI H CONH ₂ CI H CI CI CONH ₄ Ph CI H CONH ₂ CI H CI CI CONHM H Et CI CONHME Et CI Et H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO ₂ Me Me H NO ₂ Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COOH	Cl	Et		SO ₃ H					
Et CI H COMe CI H CI CI COOH nPr CI H COOH CI H CI CI CONH ₂ Ph CI H CONH ₂ CI H CI CI CONHMH H Et CI CONHMH Et CI Et H CONHMIS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO ₂ Me Me H NO ₂ Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COOH	Cl	nPr							
nPr Cl H COOH Cl H Cl CONH ₂ Ph Cl H CONH ₂ Cl H Cl CONHMe H Et Cl CONHMe Et Cl Et H CONHMS H nPr Cl NHMS nPr Cl nPr H NHMS H Ph Cl NHMS Ph Cl Ph H NO ₂ Me Me H NO ₂ Me H Me H OH Et Et Et H COMe nPr H nPr H COMe nPr nPr H COMe nPr H nPr H COMe	CI	Ph	н						
Ph	Εt	Ci	Н						
H Et CI CONHMe Et CI Et H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 Me Me H NO2 Me H Me H OH Et Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr H COOH	nPr								
H	Ph	CI	Н	CONH ₂					
H Ph Cl NHMs Ph Cl Ph H NO2 Me Me H NO2 Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COMe nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH	Н	Εt	CI						
Me Me H NO2 Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COMe nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH	Н								
Et Et H OH Et H Et H COMe nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH	н								
nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH									
mi and the second of the secon	Εt								
Ph Ph H COOH Ph H Ph H NO ₂	n₽r								
	Ph	Ph	H	COOH	Ph	H	Ph	Н	NO ₂

【0218】 【表50】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
Н	н	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	ιPr
H	Н	nPr	SO₃H	Н	nPr	Н	SO₃H	nPr
Н	н	nBu	CI	н	nBu	Н	CI	nBu
н	Н	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
Н	Н	Ph	CH ₂ OH	Н	Ph	н	CH ₂ OH	Ph
Εt	Н	Н	CH_2NH_2	н	Н	Н	CH ₂ NH ₂	
iPr	Н	Н	CH ₂ NHMe	н	H	Н	CH ₂ NHM	
nPr	Н	Н	CH ₂ Ph	Н	Н	Н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	н	Н	н	COMe	н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	Н
Ph	Н	Н	CONH ₂	Н	Н	н	CONH ₂	
Н	Εt	Н	CONHMe	Et	Н	Et	CONHM	
Н	iPr	н	CONHMs	iPr	Н	iPr	CONHM	
н	nPr	н	гМНИ	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
н	tBu	н	NO_2	tBu	н	tBu	NO ₂	н
Н	Ph	н	CHO	₽h	Н	Ph	Н	so₃H
CI	Et	Н	so₃H	Et	Н	Et	Н	SO ₂ NHMe
Ci	nPr	Н	SO₂NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Et	CI	Н	COMe	CI	Н	CI	CI	COOH
nPr	CI	Н	COOH	a	Н	a	CI	CONH ₂
Ph	CI	н	CONH ₂	a	Н	CI	CI	CONHMe
Н	Et	a	CONHMe	Ēŧ	CI	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	a	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
н	Ph	а	NHMs	Ph	CI	Ph	н	NO ₂
Me	Me	н	NO ₂	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	н	OH	Et	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
₽h	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO ₂

[0219]

【表 5 1】

R¹³ HN OH Me OH Me

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R14	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
Н	н	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	iPr
Н	н	nPr	so₃H	н	n₽r	н	SO₃H	nPr
н	Н	nBu	a	Н	nBu	H	Cl	nBu
н	н	tBu	Br	Н	tBu	н	₿r	tBu
н	Н	Ph	CH ₂ OH	н	Ph	Н	CH ₂ OH	₽h
Et	Н	н	CH2NH2	Н	Н	Н	CH ₂ NH ₂	
iPr	н	Н	CH ₂ NHMe	Н	Н	н	CH ₂ NHM	
nPr	н	н	CH₂Ph	Н	н	н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	н	COMe	н	н	Н	COMe	Н
tBu	н	Н	COOH	н	н	Н	COOH	H
Ph	н	Н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH ₂	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
н	i₽r	н	CONHMs	i₽r	Н	iPr	CONHM	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
н	tBu	Н	NO ₂	tBu	Н	tBu	NO ₂ H	Н
Н	Ph	н	CHO	Ph	Н	Ph	н	SO₃H
Cl	Εt	Н	SO₃H	Εt	н	Et	Н	SO ₂ NHMe
Cl	nPr	Н	SO₂NHMe	nPr	Н	nPr	Н	он
CI	Ph	Н	он	Ρ'n	н	Ph	н	COMe
Et	CI	Н	COMe	CI	Н	CI	Cl	COOH
nPr	CI	Н	COOH	Cl	Н	Ci	a	CONH ₂
Ph	CI	Н	CONH ₂	CI	Н	a	CI	CONHMe
Н	Et	CI	CONHMe	Et	Cl	Et	н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	Cl	nPr	Н	NHMs
н	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	₽h	Н	NO_2
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	Me	н	он
Εt	Et	Н	ОН	Εt	Н	Eì	н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	n₽ r	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	н	COOH	Ph	Н	Ph	H	NO ₂

【0220】

	_							
R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	н	Et	Н	NO ₂	Et
н	н	ıPr	CHŌ	Н	iPr	н	CHO	iPr
н	Н	nPr	SO₃H	Н	nPr	н	SO₃H	nPr
Н	н	nBu	a	н	nBu	н	Cl	nBu
н	Н	tBu	Br	Н	tBu	H	Br	tBu
н	Н	Ph	CH ₂ OH	н	Ph	н	CH ₂ OH	Ph
Et	Н	н	CH ₂ NH ₂	Н	Н	Н	CH ₂ NH ₂	
ιPr	н	Н	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHM	
nPr	Н	н	CH₂Ph	н	Н	Н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	H	COOH	н
₽h	Н	н	CONH ₂	Н	н	Н	CONH ₂	
н	Εt	Н	CONHMe	Et	Н	Et	CONHM	
Н	iPr	Н	CONHMs	iPr	Н	iPr	CONHM	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO ₂	tBu	Н	tBu	NO₂H	н
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	Ph	Н	so₃H
CI	Et	н	so₃H	Εt	Н	Et	Н	SO ₂ NHMe
CI	nPr	н	SO ₂ NHMe	nPr	н	nPr	Н	OH
CI	Ph	н	OH	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Et	Cl	н	COMe	CI	Н	CI	Cl	COOH
nPr	а	Н	COOH	CI	Н	Cl	a	CONH ₂
Ph	CI	н	CONH ₂	Cl	н	Cì	CI	CONHMe
Н	Et	CI	CONHMe	Εt	CI	Et	Н	CONHMs
н	nPr	Cl	CONHMs	nPr	a	nPr	Н	NHMs
Н	₽ħ	CI	NHMs	Ph	Cl	Ph	Н	NO_2
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	OH	Εt	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	н	соон	Ph	Н_	Ph	Н	NO ₂

[0221]

HN⊶R			
HN	HN OH	HN \	HN
HN		HN	
HN \	HN F		HN TN
ни	HN \	HN	F HN
\sim	HN	HN	HN N
HN	NH NH		HN S
ни	HN E.	HN	HN~~o~
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
HN OH	HN S	HN	En NH
HN OH	HN	N OH	

【0222】 【表54】

R¹⁴ HIN OH

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
Н	Н	i₽r	CHO	н	i₽r	н	CHO	ıPr
н	н	nPr	SO₃H	Н	nPr	Н	so₃H	nPr
н	Н	nBu	a	Н	nBu	н	CI	nBu
Н	н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
Н	н	Ph	CH ₂ OH	Н	Ph	Н	CH ₂ OF	
Et	н	H	CH2NH2	Н	Н	н	CH ₂ NH	
iPr	Н	H	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHN	4e H
nPr	Н	н	CH ₂ Ph	н	Н	Н	CH ₂ Pt	
nBu	Н	Н	COMe	н	Н	Н	COMe	
tBu	Н	H	COOH	Н	н	н	COOF	
Ph	Н	Н	CONH ₂	Н	н	Н	CONH	
н	Et	н	CONHMe	Et	Н	Et		
н	iPr	н	CONHMs	íPr	Н	iPi		
н	nPr	н	NHMs	nPr	Н	nΡ		
н	nBu	H	NHCOMe	nBu	Н	nΒ		
Н	tBu	Н	NO ₂	tBu	н	tBt		Н
Н	Ph	н	CHO	Ph	Н	Pr		SO₃H
CI	Et	Н	SO₃H	Et	Н	Et		SO ₂ NHMe
Cl	nPr	Н	SO2NHMe	nPr	Н	nΡ		OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	Н	Pf		COMe
Et	a	Н	COMe	Ci	н	C		COOH
nPr	CI	н	COOH	CI	Н	С		CONH ₂
Ph	CI	Н	CONH ₂	Cl	Н	C		CONHMe
н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Е		CONHMs
н	nPr	C)	CONHMs	nPr	a	nF		NHMs
H	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	PI		NO ₂
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	M		OH
Εt	Et	Н	OH	Εt	Н	E		COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	Н	nF		COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	P	h H	NO ₂

【表55】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	H	Et	NO ₂	н	Et	Н	NO ₂	Et
Ĥ	H	ıPr	CHÔ	Н	ıPr	Н	CHO	iPr
н	H	nPr	SO ₃ H	н	nPr	н	so₃H	n₽r
Н	H	nBu	ď	Н	n₿u	Н	CI	nBu
H	H	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
Н	H	Ph	CH ₂ OH	Н	₽h	Н	CH ₂ OH	Ph
Et	H	H	CH2NH2	Н	Н	Н		. H
ıPr	н	н	CH₂NHMe	Н	Н	н	CH ₂ NHM	
nPr	H	H	CH₂Ph	Н	Н	н	CH ₂ Ph	Н
nBu	н	Н	COMe	H	Н	н	COMe	Н
tBu	Н	н	COOH	H	н	Н	COOH	Н
Ph	н	Н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH ₂	
н	Et	н	CONHMe	Et	н	Et	CONHM	
H	iPr	н	CONHMs	iPr	н	iPr	CONHM	
H	nPr	н	NHMs	nPr	н	n₽r	NHMs	Н
H	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO ₂	tBu	н	tBu	NO_2	Н
н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	Ph	Н	SO₃H
CI	Et	Н	so₃H	Et	Н	Et	Н	SO ₂ NHMe
CI	nPr	Н	SO ₂ NHMe	nPr	н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	н	Ph	Н	COMe
Et	Ci	H	COMe	CI	Н	CI	CI	COOH
nPr	a	н	COOH	CI	Н	a	CI	CONH ₂
Ph	CI	н	CONH ₂	CI	Н	CI	CI	CONHMe
н	Et	CI	CONHMe	Εt	Cl	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	a	CONHMs	nPr	CI	пPr	н	NHMs
Н	₽h	a	NHMs	Ph	CI	₽h	н	NO_2
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	oн	Εt	Н	Et	н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	пPr	н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO ₂

【0224】 【表56】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
Н	н	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	iPr
н	н	nPr	so₃H	Н	nPr	Н	SO₃H	nPr
H	н	nBu	Cl	H	nBu	н	a	nBu
н	н	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
н	Н	Ph	CH ₂ OH	Н	Ph	Н	CH ₂ OH	
Et	Н	Н	CH ₂ NH ₂	н	н	Н	CH ₂ NH	
iPr	Н	Н	CH₂NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHN	
n₽r	н	Н	CH₂Ph	н	Н	Н	CH₂Ph	
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	н	COMe	
tBu	н	н	COOH	Н	Н	н	COOH	
₽h	Н	Н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH	
н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
Н	iPr	Н	CONHMs	iPr	н	iPr	CONHM	
н	nPr	Н	NHMs	nPr	н	nPr	NHMs	
н	nBu	н	NHCOMe	nBu	н	nBu	NHCOM	
н	tBu	Н	NO ₂	t₿u	Н	tBu	NO_2	Н
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	Ph	Н	so₃H
CI	Et	Н	so₃H	Et	Н	Et	Н	SO ₂ NHM
Cl	nPr	н	SO ₂ NHMe	nPr	н	nPr	Н	он
CI	Ph	Н	OH	₽h	Н	Ph	н	COMe
Et	Cl	н	COMe	Cl	Н	CI	CI	COOH
nPr	CI	Н	COOH	a	Н	CI	Cl	CONH ₂
Ph	Cl	Н	CONH ₂	a	Н	a	a	CONHM
Н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Et	Н	CONHM
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
н	₽h	CI	NHMs	Ph	CI	Ph	Н	NO ₂
Me	Me	н	NO ₂	Me	н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	он	Εt	н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	н	Ph	Н	NO_2

[0225]

【表57】

-12								
R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R14	R ¹⁵
Н	Н	Et.	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
H	H	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	ıPr
H	Н	nPr	SO₃H	н	nPr	н	so₃H	nPr
H	Н	nBu	a	н	nBu	Н	Cl	nBu
H	н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
н	Н	Ph	CH ₂ OH	Н	Ph	н	CH ₂ OH	Ρħ
Εt	H	Н	CH ₂ NH ₂	н	н	н	CH2NH;	
iPr	Н	н	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHM	
nPr	н	н	CH₂Ph	Н	Н	Н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	H	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	Н
Ph	н	Н	CONH ₂	Н	Н	н	CONH ₂	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	н	Et	CONHM	
Н	iPr	Н	CONHMs	iPr	н	iPr	CONHM	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	н	nPr	NHMs	Н
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	н	NO ₂	tBu	H	tBu	NO_2	н
н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	₽h	Н	so₃H
CI	Et	Н	SO₃H	Εt	Н	Εt	Н	SO ₂ NHMe
Cl	nPr	Н	SO ₂ NHMe	n₽r	Н	nPr	н	OH
Cl	Ph	Н	он	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Et	Cl	Н	COMe	Cl	Н	CI	a	COOH
nPr	a	Н	COOH	Cl	Н	CI	Cl	CONH ₂
Ph	Cl	н	CONH ₂	a	н	CI	Cl	CONHMe
Н	Et	CI	CONHMe	Εt	CI	Εt	Н	CONHMs
Н	nPr	Cl	CONHMs	nPr	CI	nPr	н	NHMs
H	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	Ph	н	NO_2
Me	Me	Н	NO ₂	Me	н	Me	Н	ОН
Εt	Et	Н	OH	Εt	Н	Εt	Н	COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	Н	nPr		COOH
Ph	Ph	н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO ₂

【0226】 【表58】

HN-R			
HN ~	HN \	HN \	HN
HN ~~	óн	HN	
HN	HN ~ F		HN \
HN	HN	HN	F HN
$\overline{\cap}$	HN	HN F	HN
HN	ſ~ NH	HN HN	HN~~S~
ни	HN F	·	HN~~0~
HN	HN	HN COOH	HN~°C
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
ни	HN TO	HN	LN NA
ни фн	HN \	N OH	

[0227]

【表59】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14
н	Et	н	NO ₂	н	н	н	NO ₂
Н	iPr	н	CHO	Н			CHO
Н	nPr	н	so₃H	н			so₃H
Н	กВน	н	CI	н			Cl
н	tBu	н	Br	н			Br
Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н			CH ₂ OH
Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н			CH ₂ NH ₂
iPr	н	Me	CH ₂ NHMe				CH ₂ NHMe
nPr	H	Me	CH ₂ Ph	н			CH ₂ Ph
nBu	Н	Me	COMe	н			COMe
tBu	H	Me	COOH				COOH
Ph	н	Et	CONH ₂	н			CONH ₂
Н	Et	Et	CONHMe	Εt			CONHMe
Н	iPr	Et	CONHMs				CONHMs
Н	nPr	iPr	NHMs				NHMs
Н	nBu	nPr					NHCOMe
Н	tBu	nBu	NO ₂				NO ₂
Н	Ph	tBu	CHO				Н
Cl	Εt	Ph	so₃H				Н
CI	nPr	CH ₂ OH					Н
Cl		CH ₂ OH			CH ₂ OH		H
Εt	CI	CH ₂ OMe					CI
nPr	CI	CH ₂ OMe					CI
Ph	CI	CH ₂ NH ₂					CI
Н	Εt	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt			н
Н	nPr	CH2NH2	CONHMs				н
Н	Ph	CH ₂ NH ₂					Н
Me	Me				CH ₂ NHMe		H
Et	Et	CH ₂ Ph	OH				н
nPr	nPr	CH ₂ Ph					
₽h	Ph	CH2CH2Pt	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
	។ ។ ។ ។ ។ ។ ។ មុ គុំ គូស្លី ៩ ។ ។ ។ ។ ។ ០០០០ ឃុំ ៩ ។ ។ ។ » ឃុំ គុំ	нинини предвитили посощетили мете	H Et H H IPT H H IPT H H IPT H H IPS H	H Et H NO2 H iPr H CHO H nPr H SO3H C C C C C C C C C C C C C C C C C C C	H Et H NO2 H H IPr H CHO H H nPr H SO3H H H nBu H CI H H Bu H Br H H Ph Me CH2NH2 H Et Ph Me CH2NH4 H nPr H Me CH2NH2 H nPr H Me CH2NH4 H nPr H Me COMH H Et Et CONH IPr H H Et Et CONHM IPr H H Ph Et Et CONHM IPr H H RBu H Me COMH IPR	H Et H NO2 H H H IPT H CHO H H H nPT H SO3H H H H nBU H ST H H H HBU H BT H H H Me CH2NH2 H Me IPT H Me CH2NHM H Me IPT H ME COME H Me IBU H ME COMH H ME IPT H ME COMH H ME IBU H ME COMH H ME IPT H ME COMH H ME IBU H ME COMH BU IPT IPT IN HOOM BU NO2 IBU NBU H NBU NO2 IBU NBU H Ph IBU CHO Ph IBU NBU CI EI Ph SO3H EI Ph CI NPT CH2OH OH Ph IBU CI EI Ph SO3H EI Ph CI NPT CH2OH OH Ph IBU CI EI Ph SO3H EI Ph CI CH2OME COME CI CH2OME NPT CH2OH COME CI CH2OME NPT CH2OH COME CI CH2OME NPT CH2OH COMH CI CH2OME NPT CH2OH COMH CI CH2OME NPT CH2NH2 CONHM EI CH2NH2 H NPT CH2NH2 CONHM NPT CH2NH2 H PP CH2NH2 CONHM NPT CH2NH2 EI EI CH2PH OH EI CH2PH NO2 ME CH2PH EI EI CH2PH OH EI CH2PH CH2PH NPT CH2PH COME COH CI CH2NH2 CH2PH NPT CH2PH COH EI CH2PH EI EI CH2PH COH EI CH2PH CH2PH NPT CH2PH COH EI CH2PH CH2PH NPT CH2PH COH EI CH2PH CH2PH NPT CH2PH COH EI CH2PH	H Et H NO2 H H H H H IPT H CHO H H H H nBU H CI H Me CH2NH2 H Me H IPT H Me CH2NH2 H Me H IPT H Me COOH H Me H IBU H Me COOH H Me H H H IBU H ME COOH H Me H H H H IBU H ME COOH H ME H H IPT ET CONHMS IPT IPT IPT INTO H IPT NHCOME INTO H

【0228】 【表60】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14
Н	н	Et	Н	NO ₂	н	Н	н	NO ₂
H	Н	iPr	Н	CHŌ	н	н	н	CHO
н	н	nPr	н	SO₃H	н	н	н	so₃H
H	Н	nBu	н	ci	Н	н	н	CI
H	н	tBu	н	Br	н	н	н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	н	Me	н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н	Me	Н	CH_2NH_2
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ıPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHŌ	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Et	Ph	Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	₽h	CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Εt	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	₽h	CI	CH2NH2	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Εt	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	₽h	н

[0229]

【表61】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	н	NO ₂	н	н	Н	NO ₂
H	н	iPr	Н	CHO	н	н	н	CHO
н	н	nPr	Н	so₃H	н	н	Н	so₃H
H	Н	nBu	н	ci	н	н	Н	Cl
H	н	tBu	Н	Br	н	н	Н	Br
Me	н	Ph	Me	CH ₂ OH	н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	E t	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н	Me	Н	CH2NH2
Me	ıPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ıPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHŌ	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Et	Ph	Εt	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	Cl	CH₂OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	Cl	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	Cl	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Εt	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH.	Et	CH₂Ph	Εt	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI		Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	H

【0230】 【表62】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴		R ¹¹	R ¹³	R14
Н	н	Et	Н	NO ₂	Н		н	н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHŌ	н		Н	Н	CHO
H	н	nPr	н	SO₃H	Н		Н	н	so₃H
H	Н	nBu	Н	ci	Н		Н	Н	CI
H	н	tBu	н	Br	Н		Н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н		Ме	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Ме	tBu	н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Εt	Ph	н	Et	CONH ₂	Н		Et	н	CONH ₂
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Et		Εt	Εŧ	CONHMe
Et	н	iPr	Εt	CONHMs	iPr		Et	1Pr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt		Ph	Εt	н
CH ₂ OH	Cl	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	a	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	н
CH₂OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH_2NH_2	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH ₂ NH ₂	Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	пPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH_2NH_2	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH_2NH_2	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me		CH ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	n₽r	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph		Ph	CH2CH2PI	1 COOH	Ph	C	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

[0231]

【表63】

HN-R			
HN~	HN~	ни	HN N
HN ~~~	óн (^)	HN \	
HN	HN	····	HN \
HN	HN	ни	F HN N
\bigcap	HN	HN C	HN ~ N
HN	NH	HN	HN S
HN	HN F	····	HN O
HN	HN	ни	HN O
ни	HNOH	HN	HN
\bigcap	HN	HN NH2	HN
HN \	····	HN. _{Me}	HN N CI
HN	HN	HN	N.J
HN OH	HN		HNNN
ни	HN	N OH	

【0232】 【表64】

•	R ¹³	R ¹⁴	R13	R ¹⁴	_	R ¹³	R ¹⁴
٠	Н	Me	NO ₂	Н	_	OMe	н
	н	Et	CHO	Н		OEt	Н
	н	íPr	so₃H	Н		OiPr	н
	Н	nPr	a	Н		OnPr	н
	н	nBu	Br	Н		OBn	н
	н	tBu	CH ₂ OH	Н		OPh	Н
	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	Н		SMe	н
	Me	Н	CH₂NHMe	Н		SEt	H
	Et	н	CH ₂ Ph	Н		SiPr	н
	iPr	н	COMe	н		SnPr	Н
	nPr	Н	COOH	н		OCH ₂ CH ₂ PI	
	nBu	Н	CONH ₂	Н		SCH ₂ CH ₂ Pt	
	tBu	н	CONHMe	Et		Н	OMe
	Ph	NO ₂	CONHMs	iPr		Н	OEt
	н	CHÕ	NHMs	nPr		CI	OiPr
	н	SO ₃ H	NHCOMe	nBu		Me	OnPr
	н	ci	NO ₂	tBu		Et	OBn
	н	Br	CHO	Ph		nPr	OPh
	н	CH ₂ OH	SO₃H	Et		Ph	SMe
	н	CH ₂ NH ₂	SO ₂ NHMe	nPr		Me	SEt
	ci	CH ₂ NHMe	OH	Ph		Et	SiPr
	a	CH ₂ Ph	COMe	a		nPr	SnPr
	Cl	COMe	COOH	a		Ph	OCH2CH2Ph
	Et	COOH	CONH ₂	Cl		NO ₂	SCOMe
	nPr	CONH ₂	CONHMe	Et		CHO	OMe
	Ph	CONHMe	CONHMs	nPr		SO₃H	OEt
	Н	CONHMs	NHMs	Ph		Cl	OnPr
	н	NHMs	NO ₂	Me		Br	SMe
	н	NHCOMe	он	Et		CH ₂ OH	SEt
	Me	CO₂H	COMe	nPr		CH ₂ NH ₂	SiPr
	Et	н	COOH	Ph		F	SPh

		K				
R ¹³	R ¹⁴	R ¹³	R ¹⁴		R ¹³	R ¹⁴
Н	Me	NO ₂	Н	-	OMe	н
H	Et	CHŌ	Н		OEt	Н
Н	ιPr	SO₃H	Н		OiPr	Н
н	nPr	Ci	Н		OnPr	Н
н	nBu	₿r	Н		OBn	н
Н	tBu	CH ₂ OH	Н		OPh	H
н	Ph	CH ₂ NH ₂	н		SMe	Н
Me	н	CH₂NHMe	н		SEt	Н
Et	Н	CH ₂ Ph	Н		SiPr	н
iPr	н	COMe	н		SnPr	Н
nPr	Н	COOH	Н		OCH ₂ CH ₂ PI	
nBu	н	CONH ₂	Н		SCH2CH2PI	
tBu	Н	CONHMe	Et		Н	OMe
Ph	NO ₂	CONHMs	iPr		Н	OEt
н	сно	NHMs	nPr		CI	OiPr
Н	SO ₃ H	NHCOMe	nBu		Me	OnPr
н	a	NO ₂	tBu		Et	OBn
н	Br	CHO	Ph		nPr	OPh
н	CH ₂ OH	SO₃H	Et		Ph	SMe
н	CH ₂ NH ₂	SO₂NHMe	nPr		Me	SEt
CI	CH ₂ NHMe	OH	₽ħ		Et	SiPr
CI	CH₂Ph	COMe	CI		nPr	SnPr
CI	COMe	COOH	Cl		Ph	OCH ₂ CH ₂ Ph
Et	COOH	CONH ₂	CI		NO ₂	SCOMe
n₽r	CONH ₂	CONHMe	Εt		CHO	OMe
Ph	CONHMe	CONHMs	n₽r		SO₃H	OEt
н	CONHMs	NHMs	₽h		Cl	OnPr
Н	NHMs	NO ₂	Me		Br	SMe
Н	NHCOMe	OH	Et		CH ₂ OH	SEt
Me	CO ₂ H	COMe	nPr		CH ₂ NH ₂	SiPr
Et	Н	СООН	Ph	_	F	SPh

【0234】

R ¹³	R ¹⁴	-	R ¹³	R ¹⁴		R ¹³	R ¹⁴
Н	Me		NO ₂	Н		OMe	Н
Н	Et		CHO	н		OEt	н
Н	iPr		SO ₃ H	Н		OiPr	Н
н	nPr		ci	н		OnPr	Н
н	nBu		Br	Н		OBn	Н
н	tBu		CH ₂ OH	н		OPh	Н
Н	Ph		CH ₂ NH ₂	Н		SMe	Н
Me	Н		CH ₂ NHMe	Н		SEt	Н
Et	н		CH₂Ph	Н		SiPr	Н
iPr	н		COMe	Н		SnPr	Н
nPr	н		COOH	н		OCH ₂ CH ₂ PI	
nBu	Н		CONH ₂	Н		SCH ₂ CH ₂ Pi	
tBu	·H		CONHMe	Εt		Н	OMe
Ph	NO ₂		CONHMs	iPr		Н	OEt
н	CHO		NHMs	nPr		CI	OiPr
н	SO ₃ H		NHCOMe	nBu		Me	OnPr
н	ci		NO ₂	tBu		Et	OBn
Н	Br		CHO	₽h		nPr	OPh
н	CH2OH		SO₃H	Εt		Ph	SMe
Н	CH ₂ NH ₂		SO ₂ NHMe	nPr		Me	SEt
CI	CH ₂ NHMe		OH	Ph		Et	SiPr
a	CH ₂ Ph		COMe	CI		nPr	SnPr
CI	COMe		COOH	CI		Ph	OCH ₂ CH ₂ Ph
Et	COOH		CONH ₂	CI		NO ₂	SCOMe
nPr	CONH ₂		CONHMe	Et		CHO	OMe
Ph	CONHMe		CONHMs	nPr		SO₃H	OEt
н	CONHMs		NHMs	Ph		Cl	OnPr
н	NHMs		NO ₂	Me		Br	SMe
н	NHCOMe		OH	Et		CH₂OH	SEt
Me	CO ₂ H		COMe	nPr		CH ₂ NH ₂	SiPr
Et	<u>н</u>	_	COOH	Ph	_	F	SPh

[0235]

【表67】

R13 R14 R13 R14 R13 R14 H Me NO2 H OMe H H Et CHO H OEt H H Et CHO H OEt H H IPr SOJH H OIPr H H IPr SOJH H OIPr H H IBU SIPr H OBn H H IBU CH2OH H OPh H H IBU CH2OH H OPh H Me H CH2NHMe H SET H IPr H COMe H SIPr H H SIPr H SIPr H SIPr H SIPr H SIPr H </th <th></th> <th></th> <th>10</th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th>			10				
H Et CHO H OEt H H iPr SO3H H OIPr H H iPr SO3H H OIPr H H nPr CI H OnPr H H nBu Br H OBn H H tBu CH2OH H OPh H H Ph CH3NH2 H SMe H Me H CH2NHM H SET H IPr H COME H SnPr H IPr H COME H SnPr H IPr H COMH ET CONHMS IPR H OME H OME H CHONHMS IPR CI OIPR H CH2NHM IPR CI OIPR H CHO NHMS IPR CI OIPR H CH2NHM IPR CI OIPR CI COMM IPR CI OIPR CI CONHM IPR CI OIPR SIPT	R13	R ¹⁴	R ¹³	R ¹⁴	_	R ¹³	R ¹⁴
H IPT SOJH H OIPT H	Н	Me	NO ₂	Н	-		
H iPr SO3H H OIPr H H nPr CI H OnPr H H nBu Br H OBn H H tBu CH2OH H OPh H H Ph CH2NH2 H SMe H Me H CH2NHM H SEt H IPr H COMe H SnPr H nPr H COMH H OCH2CH2Ph H nPr H CONHM Et H OM Ph NO2 CONHMS iPr H OEt H CHO NHMS nPr CI ONPr H COMP H SO3H NHMP ONPr H CH2NHM ET SET ONPr H CH2NHM ET SCH2CH2Ph H SCH2CH2Ph H SCH2CH2Ph H SCH2CH2Ph H OET SCH2CH2Ph SO3H ET SHPr SCH2CH2Ph SMe SET SCH2CH2Ph COMP CI NPr SNPr CI CH2Ph COMP CI NPr SNPr CI CH2Ph COMP CI NPr SNPr CI COMP COH CI NP OCH2CH2Ph CI COMP COH CI NP SNPr CI CONHM COH CI NP SNPr CI CONHM COH CI NP SNPr CI CONHM COH CI NP OCH2CH2Ph CI CONHM CH COH CH	Н	Et	CHO	н			
H			SO₃H	Н			
H		nPr	CI	Н			
H				н			
H Ph CH₂NH₂ H SMe H Me H CH₂NHMe H SEt H Et H CH₂Ph H SiPr H iPr H COMe H SnPr H nPr H COMH H SCH₂CH₂Ph H nBu H CONH₂ H SCH₂CH₂Ph H tBu H CONHMS iPr H OEt H CH0 NHMS nPr CI OnPr H SO₃H NHCOME NP NPr OPh H CH2OH SO₃H Et Ph SMe H CH₂NHMe CI CH2NHME CI CH₂NHME CI CH2NHME CI CH2NHME CI CH2NHME CI CH2Ph COME CI nPr SnPr CI COME COH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI COME COH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI COME COH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI CONHME CONHME ET CHO OME CONHME CONHME CI CH2Ph CONHME CONHME CONHME CI CH2PH CONHME CI CH2PH CONHME CI CH2PH CONHME CONHME CI CH2PH C	Н	tBu	CH ₂ OH	Н			
Me H CH₂NHMe H SEt H Et H CH₂Ph H SIPr H IPr H COMe H SnPr H nPr H COMe H OCH₂CH₂Ph H nPr H CONHMe Et H OMe nBu H CONHMe Et H OEt H CHO NHMS nPr CI OIPr H CHO NHMS nPr CI OIPr H CHO NHMS nPr CI OIPr H CHO NHMS nPr OPh OIPr OPh H CH2OH SO3H Et Ph SMe SMe H CH3NH2 SO2NHMMe nPr Me SEt SIPr CI CH2NH0e CH Ph Et SIPr OCH Ph OCH Ph OCH P	н	Ph	CH ₂ NH ₂	Н			
IPT	Me	Н	CH ₂ NHMe	Н			
IPr	Et	Н	CH₂Ph	H			
nPr H COOH H OCH2CH2Ph H nBu H CONH2 H SCH2CH2Ph H tBu H CONHMS Et H OMB Ph NO2 CONHMS iPr H OEt H CHO NHMS nPr CI OIPr H CHO NHMS nPr CI OIPr H CHO NHMS nPr CI OIPr H CH CHO Ph nPr OPh H CH2OH SO3H Et Ph SMe H CH2Ph SO2NHMB nPr Me SEt CI CH2Ph COME CI nPr SnPr CI CMP COME CI nPr OCH2CH2Ph CI COME COH CI NP OCH2CH2Ph CI COME COH CI NP OCH2CH2Ph			COMe	Н			
NBU		Н	COOH	Н			
Ph NO2 CONHMS iPr H OEt H CHO NHMS nPr CI OIPr H CHO NHMS nPr CI OIPr H SO3H NHCOME nBu Me OnPr H CI NO2 tBu Et OBn H CH Ph NME SE H CH2OH SO3H Et Ph SME H CH2NH2 SO3NHME nPr Me SEt CI CH2Ph COME CI nPr SnPr CI CMP COME CI nPr OCH2CH2Ph CI COME COOH CI NP OCH2CH2Ph CI COME COOH CI NP OCH2CH2Ph CI CONH COOH CI NP OCH2CH2Ph CO CONH Et CHO OME SCOME		н	CONH ₂	Н			
Ph NO₂ CONHMS iPr H OEt H CHO NHMS nPr CI OIPr H CHO NHCOME nBu Me OnPr H CI NO₂ tEu Et OBn H Br CHO Ph nPr OPh H CH₂OH SO₃H Et Ph SMe H CH₂NHM2 SO₂NHME nPr Me SEt CI CH₂NH2 SO₂NHME CI nPr SnPr CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr CI COME COH CI nPr SnPr CI COME COH CH Ph OH SCOME Et COOH CONHME Et CHO OME SCOME Ph CONHME Et CHO OME SOME OME Ph CONHME CONHMS <	tBu	н	CONHMe	Εt			
H CHO NHMS nPr CI OIPr H SO3H NHCOME nBu Me OnPr H CI NP2 tBu Et OBn H Br CHO Ph nPr OPh H CH2OH SO3H Et Ph SMe H CH2NH2 SO2NHME nPr Me SEt CI CH2NHME OH Ph Et SIPr CI COME COH CI nPr SnPr CI COME COH CI Ph OCH2CH2Ph CI COME COH CI Ph OCH2CH2Ph Ph CONH2 CONHME Et CHO OME Ph CONHME CONHMS nPr SO3H OEt H NHMS NO2 ME Br SME H NHCOME OH Et CH2OH SEt			CONHMs	iPr			
H SO ₃ H NHCOMe nBu Me OnPr H Cl NO ₂ tBu Et OBn H Br CHO Ph nPr OPh H CH ₂ OH SO ₃ H Et Ph SMe H CH ₂ NH ₂ SO ₂ NHMe nPr Me SEt Cl CH ₂ NHMe OH Ph Et SiPr Cl CH ₂ Ph COMe Cl nPr SnPr Cl COMe COH Cl Ph OCH ₂ CH ₂ Ph Cl COMe COH Cl Ph OCH ₂ CH ₂ Ph H CONHME ET CHO OME NPr CONHME CONHMS NPr SO ₃ H OET H CONHMS NHMS Ph Cl OnPr H NHMS NO ₂ Me Br SMe H NHCOME OH ET CH ₂ NH ₂ SiPr			NHMs	nPr			
H CI NO2 tBU Et OBn H Br CHO Ph nPr OPh CHO Ph nPr OPh H CH20H SO3H Et Ph SMe SEt CI CH2NHMe OH Ph Et SIPr CI CH2Ph COME CI nPr SAPr CI CH2Ph COME CI Ph OCH2CH2Ph Et COOH CONH2 CI Ph OCH2CH2Ph Et COOH CONH2 CI Ph OCH2CH2Ph ET CONH2 CONHME ET CHO OME Ph CONHME CONHMS nPr SO3H OET H CONHMS NHMS Ph CI ONPr H NHMS NO2 ME Br SME H NHCOME OH ET CH2NH2 SIPr			NHCOMe	nBu			
H			NO ₂	tBu			
H CH ₂ NH ₂ SO ₂ NHMe nPr Me SEt CI CH ₂ NHMe OH Ph Et SIPr CI CH ₂ Ph COME CI nPr SnPr CI COME COOH CI Ph OCH ₂ CH ₂ Ph ET COOH CONH ₂ CI NO ₂ SCOME nPr CONH ₂ CONHME ET CHO OME Ph CONHME CONHMS nPr SO ₃ H OET H CONHMS NHMS Ph CI OnPr H NHMS NO ₂ Me Br SME H NHCOME OH ET CH ₂ NH ₂ SIPr	н	Br	CHO	Ph			
H CH₂NH₂ SO₂NHMe nPr Me SEt CI CH₂NHMe OH Ph Et SIPr CI CH₂NHMe OH Ph Et SIPr CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr CI COME COOH CI Ph OCH₂CH₂Ph Et COOH CONH₂ CI NO₂ SCOME nPr CONH₂ CONHME Et CHO OME Ph CONHME CONHMS nPr SO₃H OEt H CONHMS NHMS Ph CI OnPr H NHMS NO₂ ME Br SME H NHCOME OH Et CH₂OH SEt ME CO₂H COME nPr CH₂NH₂ SIPr	н	CH ₂ OH	so₃H	Εt			
CI CH₂NHMe CH Ph Et SIPr CI CH₂Ph COMe CI nPr SnPr CI COMe COOH CI Ph OCH₂CH₂Ph Et COOH CONH CI NO₂ SCOMe nPr CONH Et CHO OMe Ph CONHME CONHMS nPr SO₃H OEt H CONHMS NHMS Ph CI OnPr H NHMS NO₂ Me Br SMe H NHCOMe OH Et CH₂OH SEt Me CO₂H COMe nPr CH₂NH₂ SIPr	н		SO₂NHMe	nPr			
CI CH ₂ Ph COMe CI ni-Pr SnPr COMe CI CI CH ₂ Ph COMe CI Ph OCH ₂ CH ₂ Ph COME CI Ph OCH ₂ CH ₂ Ph CONH ₂ CI NO ₂ SCOME CI Ph CONH ₂ CONHME Et CHO OME CONHMS nPr SO ₃ H OEt CONHMS NHMS Ph CI OnPr CI OnPr CI NHMS NO ₂ Me Br SME CI CH ₂ CH SET CH ₂ CH SET CH ₂ CH SET CH ₂ CH SET COME COME COME COME COME COME COME COME	CI	CH ₂ NHMe	OH	Ph			
CI COME COOH CI Ph OCH ₂ CH ₂ Ph Et COOH CONH ₂ CI NO ₂ SCOME NPr CONH ₂ CONHME Et CHO OME Ph CONHME CONHMS NPr SO ₃ H OEt H CONHMS NHMS Ph CI ONPr H NHMS NO ₂ Me Br SME H NHCOME OH Et CH ₂ OH SEt Me CO ₂ H COME NPr CH ₂ NH ₂ SIPr	Cl		COMe				
Pr CONH2 CONHMe Et CHO OMe	CI		COOH				
Ph	Et	COOH	CONH ₂				
H CONHMS NHMS Ph Cl OnPr H NHMS NO₂ Me Br SMe H NHCOME OH Et CH₂OH SEt Me CO₂H COME nPr CH₂NH₂ SIPr	nPr	CONH ₂	CONHMe				
H NHMS NO₂ Me Br SMe H NHCOME OH Et CH₂OH SEt Me CO₂H COME nPr CH₂NH₂ SIPr	Ph	CONHMe	CONHMs	n₽r			
H NHCOME OH Et CH ₂ OH SEt Me CO ₂ H COME nPr CH ₂ NH ₂ SIPr	Н	CONHMs	NHMs				
Me CO ₂ H COMe nPr CH ₂ NH ₂ SiPr	н	NHMs					
1/16 002/1	н	NHCOMe	, OH				
	Me	CO₂H	COMe				
	Et		COOH	Ph	_	F	SPh

【0236】 【表68】

HN-R		
HN ~~	HN HN	HN
HN ~	OH HN	
HN	HN F	HN \
HN	HN HN HN	F HN
\Box	HN F	HN N
HN	NH ₂	HN~~S~
HN	HN F	HN~~O~
HN	HN COOH	HN O
HN	HN HN	HN
····	ÓH NH2	HN
HN	HN HN Me	N= CI
HN	HN S HN	HN
ни	HN~ O	HN N
HN	HN OH	
[0	2 3 7]	

0	
R ¹¹	R ¹²
Н	Me
Н	Et
н	iPr
Н	nPr
H	nBu
Me	tBu
Me	Ph
Me	CH ₂ OH
Me	CH₂OMe
Me	CH ₂ NH ₂
Me	Me
Et	CH ₂ NH ₂
Et:	CH₂NHMe
Et	CH ₂ Ph
iPr	CH ₂ Ph
n₽r	CH₂CH₂Ph
nBu	Н
tBu	Me
Ph	Н
CH ₂ OH	Me
CH ₂ OH	Et
CH ₂ OMe	nPr
CH ₂ OMe	Ph
CH ₂ NH ₂	н
CH ₂ NH ₂	nPr
CH_2NH_2	Ph
CH ₂ NH ₂	Me
CH ₂ NHMe	Et
CH ₂ Ph	nPr
CH ₂ Ph	Ph
CH ₂ CH ₂ Ph	CH₂Ph

【0238】 【表70】

R11 R12 H Me H Et H iPr H nPr H nBu Me tBu Me Ph Me CH ₂ OMe Me CH ₂ OMe Me CH ₂ NH ₂ Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph Ne Ph H CH ₂ OMe Me Ph H CH ₂ OMe Ph CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NHMe CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph	Ö	
H Et H iPr H nPr H nBu Me tBu Me Ph Me CH ₂ OMe Me CH ₂ NH ₂ Me Me Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph nBu H tBu Me Ph H CH ₂ OMe Ne CH ₂ NHME Et CH ₂ Ph nBu H CH ₂ OMe Ph H CH ₂ OMe CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Ne CH ₂ NHME Et CH ₂ NHME CH ₂ Ph CH ₂ Ph Ph	R ¹¹	R ¹²
H iPr H nPr Me tBu Me Ph Me CH ₂ OMe Me CH ₂ OMe Me CH ₂ NH ₂ Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph NPr CH ₂ CH ₂ Ph NPr CH ₂ CH ₂ Ph Etu Me Ph H CH ₂ OH Me CH ₂ OH Me CH ₂ OH Ph CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ Ph CH ₂ Ph Ph	Н	Me
H	Н	Et
H	Н	i₽r
Me tBu Me Ph Me CH₂OH Me CH₂OHe Me CH₂NH₂ Me Me Et CH₂NH₂ Et CH₂Ph iPr CH₂Ph iPr CH₂Ph nBu H tEu Me Ph H CH₂OH Et CH₂OH Et CH₂OMe Ph CH₂NH₂ H CH₂NH₂ Ph CH₂NH₂ Ph CH₂NHMe Et CH₂NHMe Et CH₂Ph Ph CH₂Ph Ph CH₂Ph Ph	Н	nPr
Me Ph Me CH ₂ OH Me CH ₂ OMe Me CH ₂ NH ₂ Me Me Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph nPr CH ₂ CH ₂ Ph nBu H tBu Me Ph H CH ₂ OH Me CH ₂ OH Ph CH ₂ OH Ph CH ₂ OH Et CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph Ph	Н	
Me CH₂OH Me CH₂OHe Me CH₂NH₂ Me Me Et CH₂NHMe Et CH₂NHMe Et CH₂Ph iPr CH₂Ph nPr CH₂Ph nBu H tBu Me Ph H CH₂OH Me CH₂OH Ph CH₂OH Ph CH₂OH Ph CH₂OH Et CH₂OME Ph CH₂OME Ph CH₂NH₂ H CH₂NH₂ Ph OH₂NH₂ Ph OH₂NH₂ Ph OH₂NH₂ Ph CH₂NHME Et CH₂Ph Ph	Me	
Me CH₂OMe Me Me CH₂NH₂ Me Me Et CH₂NHMe Et CH₂Ph iPr CH₂CH₂Ph nPr CH₂CH₂Ph nBu H tBu Me Ph H CH₂OH Et CH₂OMe nPr CH₂OMe Ph CH₂OMe Ph CH₂NH₂ H CH₂NH₂ NPr CH₂NH₂ NPr CH₂NH₂ NPr CH₂NH₂ NPr CH₂NH№ Et CH₂NHME Et CH₂NHME Et CH₂NHME Et CH₂NHME Et CH₂NHME Et CH₂Ph nPr CH₂Ph Ph		
Me		
Me Me Et CH₂NHMe Et CH₂Ph iPr CH₂Ph iPr CH₂Ph nBu H tBu Me Ph H CH₂OH Me CH₂OH Me CH₂OMe nPr CH₂OMe Ph CH₂NH₂ H CH₂NH₂ NPr CH₂NH₂ NPr CH₂NH₂ NPr CH₂NH₂ NPr CH₂NH₂ NPr CH₂NH№ Et		
Et CH ₂ NH ₂ Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph nPr CH ₂ CH ₂ Ph nBu H tBu Me Ph H CH ₂ OH Me CH ₂ OH Et CH ₂ OMe Ph CH ₂ NH ₂ H CH ₃ NH ₂ H CH ₃ NH ₂ Ph CH ₃ NH ₂ Ph CH ₃ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHME Et CH ₂ NHME Et CH ₂ Ph Ph		
Et CH2NHMe Et CH2Ph iPr CH2Ph nPr CH2CH3Ph nBu H tBu Me Ph H CH2OH Et CH2OME nPr CH2OME Ph CH2NH2 NPr CH3NH2 NPr CH3NH2 NPr CH3NH2 Me CH3NH2 Me CH2NH2 Me CH2NH2 Me CH2NH2 Ph CH3NH2 Me CH2NHME Et CH2NHME Et CH2NHME Et CH2Ph nPr CH2Ph Ph		
Et CH ₂ Ph iPr CH ₂ Ph nPr CH ₂ CH ₂ Ph nBu H tBu Me Ph H CH ₂ OH Et CH ₂ OMe nPr CH ₂ OMe Ph CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph Ph		
iPr CH₂Ph nPr CH₂Ph nBr H tBu Me Ph H CH₂OH Me CH₂OH Et CH₂OMe nPr CH₂MH₂ H CH₂MH₂ NPr CH₂MH₂ Ph CH₂NH½ Me CH₂NH½ Me CH₂NH½ Ph CH₂NH½ Me CH₂NH½ Me CH₂NHME Et CH₂Ph Ph		
nPr CH2CH2Ph nBu H tBu Me Ph H CH2OH Me CH2OH Et CH2OMe nPr CH2OMe Ph CH2NH2 H CH2NH2 NPr CH2NH2 Ph CH2NH4 Me CH2NHMe Et CH2Ph nPr CH2Ph Ph		
nBu H tBu Me Ph H CH ₂ OH Me CH ₂ OH Et CH ₂ OMe nPr CH ₂ OMe Ph CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph nPr CH ₂ Ph Ph		
tEu Me Ph H CH ₂ OH Me CH ₂ OH Et CH ₂ OMe nPr CH ₂ OMe Ph CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMME Et CH ₂ Ph Ph		
Ph H CH2OH Me CH2OH Et CH2OMe nPr CH2OMe Ph CH2NH2 H CH2NH2 Ph OH2NH2 Me CH2NHME Et CH2Ph nPr CH2Ph Ph		
CH ₂ OH Me CH ₂ OH Et CH ₂ OMe nPr CH ₂ OMe Ph CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Ph		
CH2OH Et CH2OMe nPr CH2OMe Ph CH2NH2 H CH3NH2 nPr CH2NH2 Ph CH3NH2 Me CH2NHME Et CH2Ph nPr CH2Ph Ph		
CH20Me nPr CH20Me Ph CH2NH2 H CH3NH2 nPr CH2NH2 Ph CH3NH2 Me CH2NHME Et CH2Ph Ph		
CH ₂ OMe Ph CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph nPr CH ₂ Ph Ph		
CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ nPr CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph nPr CH ₂ Ph Ph		
CH2NH2 nPr CH2NH2 Ph CH2NH2 Me CH2NH4 Et CH2Ph nPr CH2Ph Ph		
CH ₂ NH ₂ Ph CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph nPr CH ₂ Ph Ph		
CH ₂ NH ₂ Me CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph nPr CH ₂ Ph Ph		
CH ₂ NHMe Et CH ₂ Ph nPr CH ₂ Ph Ph		
CH₂Ph nPr CH₂Ph Ph		
CH₂Ph Ph		
CH2CH2H CH2H		
	C112C112F1	Ot 12: 11

[0239]

	【表 7	1]
\mathbf{R}^{11}	ни	
O N	Y Y)H √Ie
R ¹² /N	O Me	1

0	
R ¹¹	R ¹²
н	Me
н	Et
н	iPr
н	nPr
Н	nBu
Me	tBu
Me	Ph
Me	CH ₂ OH
Me	CH ₂ OMe
Me	CH ₂ NH ₂
Me	Me
Et	CH ₂ NH ₂
Et	CH₂NHMe
Εt	CH ₂ Ph
iPr	CH ₂ Ph
nPr	CH ₂ CH ₂ Ph
nBu	Н
tBu	Me
Ph	Н
CH ₂ OH	Me
CH ₂ OH	Et
CH ₂ OMe	nPr
CH ₂ OMe	Ph
CH ₂ NH ₂	н
CH ₂ NH ₂	nPr
CH ₂ NH ₂	Ph
CH ₂ NH ₂	Me
CH ₂ NHMe	Et
CH ₂ Ph	nPr
CH₂Ph	Ph CH₂Ph
CH ₂ CH ₂ Ph	CH2PII

【0240】 【表72】

,11		O Me	
٠	R ¹¹	R ¹²	
•	Н	Me	
	Н	Εt	
	Н	iPr	
	Н	nPr	
	н	nBu	
	Me	tBu	
	Me	Ph	
	Me	CH ₂ OH	
	Me	CH ₂ OMe	
	Me	CH ₂ NH ₂	
	Me	Me	
	Et	CH2NH2	
	Et	CH ₂ NHMe	
	Et	CH ₂ Ph	
	iPr	CH ₂ Ph	
	nPr	CH ₂ CH ₂ Ph	
	nBu	¯H ¯	
	tBu	Me	
	Ph	н	
	CH ₂ OH	Me	
	CH ₂ OH	Et	
	CH ₂ OMe	nPr	
	CH ₂ OMe	Ph	
	CH ₂ NH ₂	Н	
	CH ₂ NH ₂	nPr	
	CH ₂ NH ₂	Ph	
	CH ₂ NH ₂	Me	
	CH ₂ NHMe	Et	
	CH ₂ Ph	nPr	
	CH ₂ Ph	₽h	
	CH ₂ CH ₂ Ph		
			٠,

[0241]

HN-R			
HN~	HN OH	HN~~	HN N
HN	HN	HN	HN
HN \	HN	HN~~	e HN N
··· \	HN	HN	HN N
HN~	NH NH	HN HN	HN~~~S~
HN	HN F	į (Č)	HN O
HN	HN	HN COOH	HN N
HN	HN OH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
ни		HN HN	HN N CI
HN	HN		An nH
HN OH	HN	N OH	

【0242】 【表74】

[0243]

[0244]

【表76】

R ¹¹	R ¹²
Н	Me
н	Et
н	iPr
Н	nPr
Н	nBu
Me	tBu
Me	₽h
Me	CH ₂ OH
Me	CH ₂ OMe
Me	CH ₂ NH ₂
Me	Me
Et	CH ₂ NH ₂
Εt	CH ₂ NHMe
Et	CH ₂ Ph
iPr	CH₂Ph
nPr	CH ₂ CH ₂ Ph
nBu	н
tBu	Me
Ph	Н
CH ₂ OH	Me
CH ₂ OH	Et
CH ₂ OMe	nPr
CH ₂ OMe	Ph
CH ₂ NH ₂	н
CH ₂ NH ₂	nPr
CH ₂ NH ₂	Ph
CH ₂ NH ₂	Me
CH ₂ NHMe	Et
CH ₂ Ph	nPr
CH ₂ Ph	Ph
CH ₂ CH ₂ Ph	CH₂Ph

		【表77	7]
	R ^{II} H		\supset
_	N A	Д он	
°₹	\mathcal{L}^{N}	Y	
0		·Mo	
Ü	R ¹²	Me	
	R ¹¹	R ¹²	
,	Н	Me	•
	Н	Et	
	н	iPr	
	Н	nPr	
	н	nBu	
	Me	tBu	
	Me	Ph	
	Me	CH ₂ OH	
	Me	CH ₂ OMe	
	Me	CH ₂ NH ₂	
	Me Et	Me CU NU.	
	Et	CH ₂ NH ₂ CH ₂ NHMe	
	Et	CH ₂ N nwe	
	ıPr	CH ₂ Ph	
	nPr	CH ₂ CH ₂ Ph	
	nBu	Н	
	tBu	Me	
	Ph	Н	
	CH ₂ OH	Me	
	CH ₂ OH	Et	
	CH ₂ OMe	nPr	
	CH ₂ OMe	₽h	
	CH ₂ NH ₂	н	
	CH ₂ NH ₂	nPr	
	CH_2NH_2	Ph	
	CH ₂ NH ₂	Me	
	CH ₂ NHMe		
	CH ₂ Ph	nPr	
	CH ₂ Ph	Ph OU 5th	
	CH ₂ CH ₂ Pt	1 CH ₂ Ph	_
		0 2 4	6 1

【0246】 【表78】

HN-R			
HN	HN OH	ни	HN
HN		ни	HN
HN	HN	HN~~	
HN	HN	HN	F HN
HN	HN NH	F	HN N
\cap	HN	2 HN F	HN O
HN	HN	HN COOH	HN~O
HN			
HN	HNOH	HN NH ₂	HN ~
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN	HN N CI
ни	HN		HN N
ни√он	HN	N OH	-

【表79】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14	,	R ¹¹	R ¹³	R14
Н	Н	Et	Н	NO ₂	Н		н	н	NO ₂
H	Н	iPr	н	CHO	н		н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	so₃H	н		Н	Н	SO₃H
H	Н	nBu	н	CĬ	н		Н	Н	CI
Н	н	tBu	н	Br	H		н	н	Br
Me	Н	н	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	íPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н		Me	н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н		Me	Н	CH₂Ph
	nBu	H	Me	COMe	н		Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	н		Εt	Н	CONH ₂
Et	н	Et	Εt	CONHMe	Εt		Et	Εt	CONHMe
Et	н	ıPr	Et	CONHMs	iPr		Et	íPr	CONHMs
(Pr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	n₽r	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	₽h	Н
Ph	a	Et	Ph	SO₃H	Εt		₽h	Et	H
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	н
CH₂OH	CI	₽h	CH ₂ OH	OH	Ph			Ph	н
CH₂OMe	Et	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	Cl	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH ₂ NH ₂	Εt	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	₽h	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe		Мe	0	H ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	Н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH2CH2Pt	COOH	Ρħ	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
	1 (721	Q						

【0248】 【表80】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14		R ¹¹	R ¹³	R14
Н	н	Et	Н	NO ₂	н		н	н	NO ₂
H	н	ıPr	н	CHŌ	н		Н	Н	CHO
Н	Н	nPr	н	so₃H	Н		Н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	н	CI	Н		Н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	Н		н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH ₂ OH	Н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н		Εt	Н	CONH ₂
Et	н	Εt	Et	CONHMe	Εt		Et	Et	CONHMe
Et	Н	ıPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NНСОМе
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Et		Ph	Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	Cl	Ph	CH ₂ OH	OH	Ρh		CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Εt	CI	CH ₂ OMe	COMe	Cl		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OM e	COOH	CI		CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH ₂ NH ₂	Εt	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH ₂ NH ₂	nPr	н .
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH₂NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe		Me	C	H ₂ NHMe	Me	Н
CH ₂ Ph	Εt	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt		CH ₂ Ph	Et	H
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nΡr		CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	COOH	Ph	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

[0249]

【表81】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R11	R13	R14
Н	н	Et	н	NO ₂	н	н	н	NO ₂
H	Н	iPr	Н	сно	Н	н	н	CHO
н	Н	nPr	Н	so₃H	Н	н	Н	so₃H
н	н	nBu	н	ď	Н	Н	Н	CI
H	Н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Ме	Н	Н	Me	CH ₂ OH	Н	Me	Н	CH ₂ OH
Ме	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	Н	Me	Н	CH₂Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	н	íPr	Et	CONHMs	íPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ıPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	ИНСОМе
nBu	Н	tBu	ո⊟ս	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Εt	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	Ci	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Εt	CI	CH ₂ OMe	COMe	Cì	CH ₂ OMe	CI	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH₂ÑHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe		Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	'n₽r	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	1 COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	н

【0250】 【表82】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ^{1 4}
Н	Н	Et	Н	NO ₂	Н	Н	Н	NO ₂
H	Н	iPr	Н	CHŌ	Н	н	Н	CHO
H	н	nPr	н	SO ₃ H	Н	н	Н	so₃H
H	Н	nBu	Н	a	Н	Н	Н	CI
н	н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Me	н	н	Me	CH ₂ OH	Н	Me	н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н	Me	Н	CH_2NH_2
Me	iPr	Н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	H	CH ₂ NHMe
Ме	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	H	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Εt	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	1Pr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	₽h	SO₃H	€t	Ph	Et	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	H
CH ₂ OH	Cl	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	Cl	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Εt	H
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe		Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	n₽r	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
	0	$\frac{1}{2}$ 5	1					
	_		_					

【表83】

		Me	
HN-R			
HN ~	HN OH	HN	HN
HN		HN	
HN \	HN	HN~~	
HN	HN CI		F HN N
HN .	HN	HN	HN N
(A)	HN-	HN IN	HN S
HN	F		HN
HN~	HN ~	ни соон	HN
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
HN \	HN \	HN	LN NH
НN ∕ ∫ ∕ ∕ ∕	HN	HN	Ü
		он	

【0252】 【表84】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴		R ¹¹	R13	R ¹⁴
н	н	Et	Н	NO ₂	Н		Н	н	NO ₂
H	H	iPr	H	CHO	н		H	Н	CHO
H	Н	nPr	н	SO ₃ H	Н		Н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	н	ã	Н		Н	Н	Cl
н	н	tBu	н	Br	н		Н	н	Br
M.e	Н	н	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	H		Ме	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nРr	н	Me	CH₂Ph	н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н		Me	н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н		ме	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et		Et	Et	CONHMe
Ēt	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO_2	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Et		Ph	Εt	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nΡr		CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	Cl		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI			CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt		CH_2NH_2	Et	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs			CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	H
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	C	H ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Εt	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	₽h	CH ₂ CH ₂ PI	COOH	Ph	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
		$\frac{1}{2}$ 5	3 1						

【表85】

R ¹¹	R ¹³	R ^{1.4}	R ¹¹	R ¹³	R14	R1	1	R ¹³	R14
Н	Н	Et	Н	NO ₂	н	Н		Н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHO	н	Н		Н	CHO
н	Н	nPr	Н	so₃H	н	Н		н	so₃H
H	н	nBu	н	CĪ	н	Н		Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	н	H		н	Br
Me	Н	н	Me	CH ₂ OH	н	M		Н	CH ₂ OH
Me	Εt	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н	M		Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	M		Н	CH ₂ NHMe
Мe	nPr	Н	Me	CH ₂ Ph	н	M		Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	М		Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	М		Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	н	E		Н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Εt	E		Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	E		iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iF		nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nf		nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nE		tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	ŧE		Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	€t	P		Εt	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	пPr	CH ₂		nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OН	Ph		OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Εt	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI		OMe	CI	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	CI		OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		NH_2	Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		NH_2	Ph	H
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH₂NHMe		Me		ИНМе	Me	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Et		₂ Ph	Et	н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	COOH	Ph	CH₂C	H₂Ph	Ph	Н

【0254】 【表86】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
н	н	Et	Н	NO ₂	Н	Н	Н	NO ₂
H	Н	iPr	Н	CHŌ	·H	н	Н	CHO
н	Н	nPr	н	SO₃H	Н	н	Н	SO ₃ H
Н	Н	nBu	Н	Cl	Н	н	н	CI
н	Н	tBu	н	Br	Н	н	н	Br
Me	Н	Н	Me	CH ₂ OH	Н	Me	н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	Н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
íPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	₽h	Н
Ph	Cl	Et	Ph	so₃H	Et	Ph	Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	₽h	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Ме	Me	CH₂NHMe		Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Εt	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt	CH ₂ Ph	Et	н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pł	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	н

[0255]

【表87】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	Н	NO ₂	Н	н	Н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHÔ	Н	Н	Н	CHO
Ĥ	н	nPr	н	SO ₃ H	н	н	Н	SO₃H
H	н	nBu	н	ci	н	н	Н	CI
Н	Н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	н	н	Me	CH ₂ OH	н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	₽h	Me	CH ₂ NH ₂	н	Me	Н	CH_2NH_2
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	H	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	€t	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ίPr	Εt	1Pr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	пРr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt	₽h	Et	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	Cl	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	Cl	Cl
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	Cl	CH2NH2	CONH ₂	Cl	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe		Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Et	CH ₂ Ph	Εt	н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph 	_Ph	H
	,	· ~ -	~ 1					

【0256】

HN-R			
ни	HN OH	ни	HN
HN~~~		HN	
HN	HN		HN
ни	HN	HN	F HN N
\sim	HN	HN F	HN N
HN	NH NH	. 11 -21	HN~~S~
ни	HN	HN	HN O
HN	HN	HN	HN~O
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN	HN	HN	HN
HN	HN	HN -Me	HN N CI
ни	HN		HN N
ни	HN	N OH	
[0	257]		

HN-R			
HN	HN ~	ни	HN N
HN	о́н 	ни	
HN	HN F		HN \
HN	HN CI	ни	F HN
	HN	HN CF	HN ~ N
HN~~	NH.	HN	HN~~S~
HN	HN F	L t	HN O
HN	HN VI	HN COOH	HN
HN	HN	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN T	HN Ne	HN N CI
ни	HN		HN N
HN	ни	N OH	

【0258】 【表90】

ни	HN HN
HN 💭	HN HN
\sim	он 🗸
HN	HN HN
HN \	HN HN F
ни	HN HN
HN	I ~
····	HN N N N
HN	HN S HN
HN \	HN O
	HN HN
\bigcap	HN HN S
HN	HN O HN CO
	HN H

		1416	
HN-R			4
HN F	HN NH ₂	HN	HN CI
HN F	HOOHN	MeHN HN	HN
HN	HN CO ₂ H	NHCH₂P	h Me N Me
HN F	HN CO₂Me	HN NH	AC DMe
HN NH ₂	H ₂ NOC	MeO ₂ SHN	HN H2N
HN OH	HN NO ₂	NHSO₂E	t Ph
HN	HN	NH₂ CN	HN
HN OH	Me O HN	HN	HN
HN OH OH	OCF ₃	HN CI	SH HN

【0260】 【表92】

HNR		
HN SO ₃ H	HN OEt	HN Me
H ₂ NO ₂ S	Me OCO	OMe
CH₂OH	NHCOOE	HN OMe
COCH3	HN	HN OMe
HN	HN OCOCH3	HN NO ₂
HN	HN OH	HNCOMe
HN C	OH Me	HN NHCOPh Br
HN CCO	OH Br	HN H

【表93】

HN-R		
HN Me	HN	HN
HN-N	HN	HN
HN	HN ~~ N	HN NH ₂
HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN NH	HNOMe
HN	OH OH	HN
HNON	HN H	HN N
HN N	HN	HN O
HN N	HN	HN NH ₂
HN~~o	HN	HN CI
HN O		CI

【0262】 【表94】

HN-R			
HN S	HN N	HN N	HN N N
HN N-N	HN N	HN	HN
HN N	HN N	HN	HN N
HN NS	HN N	HN	HŅ-(
HN N CI	HN N CI	HN NH	HN
N		HN	CN_NH
HN	HN N	, FN	N
HN N	HN	J HN~~	HN JN
HN~ T°	HN	HN N-S	HN
HN S	HN	HN YN C	HN TH
10	2631		

【表95】

HN-R			
HN ~	HN ~	ни	HN
HN	óн . Г	HN	
HN	HN		HN
HN	HN	HN	-F HN N
\cap	HN	HN	HN N
HN		HN~	HN~~S~
HN	HN F	ļ.	HN O
HN	HN ~	HN COOH	HN~°
HN ~	HN	F NH2	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN	HN N CI
ни	HN		HN N
ни	ни	N OH	

【0264】 【表96】

HN-R			
HN	HN OH	HN	HN N
HN	HN C	HN	
HN	F	ни	
HN	HN	HN	F HN
HN	HN NI	1 ₂	HN S
HN ~	HN~	HN	HN
HN \	HN	HN COOH	HN~°
HN	HNOH	F HN	HN
\bigcap	HN	HN → NH ₂	HN
HN	8	HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	HN N
HN OH	HN		B
HIN	ни	он	

【表97】

HN-R			
HN ~	HN OH	ни	ни
HN		ни	
HN	HN	HN~~	
HN	HN		F HN N
HN \	HN	HN	HN N
ΠN .	HN	HN N	HN
HN	···· F		HN O
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HN OH	HN NH2	HN
HN	HN		HN
HN -		HN Me	HN N CI
	§ 🕥	HN	HN N
HN OH	ни		<i>B</i>
	ни	" он	

【0266】 【表98】

HN-R			
ни~~	HN OH	ни	HN N
HN	HN \	HN	HN N N C
HN	F	HN~~	8
HN	HN	HN \	-F HN
HN	HN		HN S
HN	HN	HN	HN~~O~
HN \	HN	HN COOH	HN~O
HN	HNOH	.F HN NH ₂	HN
HN	ни	HN HN Me	HN
HN	HN	HN HN	HN N CI
HNOH	ни		HN N
HN	HN	N OH	

【表99】

HN-R			
HN	HN OH	HN ~	HN
HN	HN F	HN C	HN
HN	HN CCI	HN	F HN N
HN	HN NH ₂	HN \	HN S
HN~	HN F	HN COOH	HN 0 1
HN HN	HN OH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N=
HN	HN	HN	HN N CI
HN OH	HN	N OH	HN N

【0268】 【表100】

HN -R			
ни	HN \	ни	HN N
HN	óн 	ни	HN
ни	HN	HN~~	1
HN	HN CI	HN	^E HN ✓ N
HN~	HN	Ų√ _F	HN N
	HN	2 HN	HN~~S~
HN	F	HN \	HN O
HN	HN	COOH	HN
HN	HN	HN NH ₂	HN
HN		ни	HN
-1		HN -Me	HN N CI
HN	HN	HN	L'N'
ни	HN		HN
ни	HN \	N OH	

【表101】

HN-R			
ни	HN OH	HN~~	HN
HN	HN O	HN^O	
ни	F	HN~~	°
HN	HN	HN \	F HN
HN	HN NH	, F	HN~~S~
HN	ни	HN	HN O
HN \	HN F	ни соон	HN
HN ~	HN OH	HN NH ₂	HN
HN C	HN \		HN
HN	LINI CO	HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	LN NH
ÓH HN ∕ Ó	HN	N OH	· ·

【0270】 【表102】

HN-R			
HN	HN OH	HN~~	HN N
HN	_	HN O	HN N N
HN	F	HN~~	, (
HN	HN	HN \	F HN
HN	HN NH ₂	√ F	HN S
HN CO	ни	HN F	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN~~O
HN	HN	HN	HN
HN	ÓН HN	HN H2	HN
HN	*	HŅ. We	HN N CI
L	HN	HN	HN N
HN OH	HN		
	TIN T	OH	

HN HN OH HN OH HN ON OH HN OH OH				
HN OH HN F HN S HN OH HN F HN N HN OH HN F HN N HN OH HN O HN OH HN OH HN OH	HN-R			
HN HN F HN S HN S	HN	HN OH	HN	ни
HN HN S HN COOH HN O HN N N N N N N N N N N N N N N	HN		HN	HN N N
HN HN S HN	HN		~~~~	i
HN HN S HN O HN	HN		HN.	·F HN
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$			HN C	HN NO
HN HN COOH HN OH HN O	HN ~		¹ 2	HN~~S~
HN HN COOH HN HN COOH HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN HN	LIN CO	HN	HN	HN
HN H	[]	JINI OF	HN \	HN
HN H	HN			N
HN HN HN N HN N HN N HN N HN N HN N HN	HN~		HN	HN
HN HN HN N HN N HN N HN N HN N HN N HN				HN
HN HN HN N	HN	HN	HN. HN. Me	N=\
HN OH HN N	HN -	HN		HN N
OH HN N	uni~~		·** 📥	LN NA
	он	. ' 🕥		Ď
	HN, A	HN		

【0272】 【表104】

HN-R			
ни	HN OH	HN~~	HN N
HN		HN^O	HN N N
HN	HN	ни	!
HN	HN		F HN N
$\overline{\cap}$	HN	HN F	HN N
HN	NH ₂	HN	HN~~S~
HN	HN F.	,,,, İ	HN O
HN ~	HN	ни соон	HN
HN	HN OH	HN NH2	HN
HN	HN T	HW CO	HN
HN		HN HN Me	HN N CI
ни	HN I		HN N
ÓΗ HN ↑	HN	N OH	

【表105】

HN-R			
HN ~	HN OH	ни	ни
HN		ни	HN
HN	HN	HN~~	I
HN	HN	HN ~	F HN O
HN ~	HN	√√ _F	HN N
\cap	HN	HN F	HN ~ O ~
HN	HN F	HN COOH	HN~~°
HN			
HN	HNOH	HN NH2	HN ~
HN	ни	HN HN Me	HN NS
HN	HN		HN N CI
ни	HN	HN	HN N
ни	ни	N OH	Ĵ

【0274】 【表106】

HN HN HN HN HN HN HN S HN HN HN F HN O HN HN HN S HN OH HN OH HN O HN OH HN OH HN OH	HN -R			
HN HN F HN S HN ~	LIIA I	HN O	HN	
HN HN F HN S HN		HN O	HN N	
HN HN S HN	HN	F F	HN	
HN HN S HN S HN O HN O HN O HN O HN O HN	HN			F HN N
HN H	- 1)		11 .1	HN N
HN HN HN COOH HN O HN O HN O HN O HN O H	HN	1 1		HN~~S~
HN COOH HN H	HN	F	Ė	HN~~O~
HN HN HN HN N	HN \	HN	HN COOH	HN O
HN HN HN HN N HN N N N N N N N N N N N	HN	HN OH	HN NIH	HN
HN HN HN N	HN	HN	HN	HN N
HN OH HN N	HN			HN N CI
HN HN HN				Lin Ville
OH OH		HN	N OH	

HN-R			
HN ~	HN OH	HN	HN
HN	HN	HN	HN
HN \	HN	HN~~	E HN N
···· U	CI	HN	HN
HN	HN		HN~~S
HN-~	HN F	HN	HN~~O~
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	F HN NH ₂	HN
HN~	LINCO	HN	HN
HN L		ни .Ме	HN N CI
1	HN	HN	N N
HN OH	HN	N	<i>B</i>
	·**	, oн	

【0276】 【表108】

HN-R			
HN	HN OH	HN \	HN
HN	_	HN C	
HN	HN F	ни	o N
HN	C	HN C	HN N
HN	HN NH:		HN
HN	HN F.	HN F	HN~~0~
HN~	HN	HN COOH	HN~°
HN O	HN OH	HN	HN
HN		NH₂ HN	HN
HN	8	HN Me	HN N CI
i .	HN	HN	HN N
HN OH	HN	NOH	Ъ
		ОН	

HN-R			
HN ~	HN OH	ни	и Ои
HN		HN^	HN N N
HN \	HN	HN~~	···
HN	HN	HN \	F HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN	ни	Ų, _F	HN ~ N
	HN	HN F	HN O
HN	HN F	HN	HN ~ O
HN		соон Г	
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
HN	HN	HN	LN NH
ни Он	HN	N OH	U
	···········		

【0278】 【表110】

HN-R			
HN	HN OH	HN	HN
HN	HN	HN	
HN	F	HN~~	
HN	HN CI	HN	F HN
HN	HN N	1 ₂	HN S
HN	HN F.	HN	HN~~0~
HN	HN	HN COOH	HN~O
HN	HNOH	F HN	HN
HN	HN	HN NH2	HN
ни	8	HN. Me	HN N CI
1	HN	HN	HN N
HN OH	HN		, <i>b</i>
<u> </u>	····	он	

【表111】

HN-R			
ни	HN OH	HN \	HN NO
HN \	HN	HN	HN
HN~	HN	HN ~	F HN N
	HN	HN C	HN~NO
HN~~	r NH	HN HN	HN
HN	HN F	₽ HN ✓	HN O
HN	HN	F COOH	HN
HN ~	HN OH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N
HN	HN	HN	HN N CI
HN OH	HN		ни~ и
HN	ни	N OH	

【0280】 【表112】

HN-R	_		
HN ~	HN \	ни	HN N
HN	óн П	ни	HN N N
HN	HN F	HN~~	
HN	HN		F HN N
	HN	HN F	HN
HN	HN	2 HN	HN S
HN~	F		HN ~ O
HN	HN ~	HN COOH	HN N.
HN	HN	HN NH2	HN
HN \	HN		HN N
1		HN	HN N CI
HN	HN	HN	N-J
ни	HN		HN
HN	HN	ОН	

HN-R			
HN ~~	HN OH	HN ~	HN N
HN	HN	HN	HN N N
HN	F	ни	
HN	HN	ни	F HN
HN \	HN N-	√F 1 ₂	HN S
HN ~	HN	HN F	HNO
HN~	HN O	HN COOH	HN~°°
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN CO	HN	HN	HN
HN \		HN Me	HN N C
HN T	HN	HN	HN N
ни	ни	N OH	·

HN-R	_		
HN ~~	HN \	HN~~	HN N
HN	о́н 	HN^O	HN N N
HN	HN F	HN~~	i
HN	HN	HN \	F HN O
HN	HN	√√ _F	HN N
\cap	HN	2 HN	HN O
HN T	HN F	HN COOH	HN O
HN			
HN	HNOH	HN NH2	ни
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN	HN N C
ни 🔨	HN S		The MH
HN OH	ни	N OH	·

【0284】 【表116】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹³	R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴
Me	Et	Н	ОН	H CH₂OH
Me	iPr	н	OMe	H CH₂NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Et	OCF ₃	H CH ₂ Ph
Me	tBu	iPr	OnPr	Me CH ₂ CH ₂ Ph
Et	Me	₽h	OiPr	Me COMe
iPr	Et	Н	Ph	Me COOH
nPr	iPr	Me	SEt	Me CONH ₂
nBu	nPr	Et	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	iPr	NH_2	Et CONHMs
OMe	н	н	NHMe	Et NHMs
OEt	Me	Н	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	Н	NHPh	Et NO ₂
OPh	iPr	CH ₂ OH	Me	iPr CHO
SEt	Н	CH ₂ NH2	Et	iPr SO₃H
SiPr	Me	CH ₂ NHMe	iPr	ıPr SO₂NHMe
NH ₂	Н	CH₂Ph	н	ıPr OH
NHMe	Me	CH ₂ CH ₂ Ph	Н	NHMs CI
NHEt	Ph	COMe	Н	NHCOMe CI
NHPh	Н	COOH	Н	NO ₂ CI
CI	Me	CONH ₂	н	CHO Br
Ci	Et	CONHMe	н	SO₃H Br
a	Ph	CONHMs	Me	SO ₂ NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	Ci	NHCOMe	Me	CI NHMs
Ph	CI	NO ₂	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO ₂
Br	Cl	so₃H	Eì	Br CHO
Me	Br	SO₂NHMe	Et	Br SO₃H
Cl	Br	OH	Et	Br SO ₂ NHMe

R¹³ R³³ R¹³ R³³ R¹³ R³³ R³³ <th></th> <th></th> <th></th>			
Me iPr	R ¹³ R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴
Me nPr Me OEt H CH₂NHMe Me nBu Et OCF3 H CH₂NHMe Me tBu iPr OnPr Me CH₂CH₂Ph Et Me Ph OiPr Me COMe iPr Et H Ph Me COMe iPr Et SIPr Me CONHMs nBu nPr Et SIPr Me CONHMs nBu nPr Et SIPr Me CONHMs Me OMe H NHMe Et NHMs CONHMs NHMs NHMs NHCOMe ONHMs NHCOMe ONHMs NHCOMe IPr CHO DNHMs ONHMs IPr ONHMs IPr CHO NHMs IPr ONHMs IPr <td< td=""><td>Me Et</td><td>н он</td><td>H CH₂OH</td></td<>	Me Et	н он	H CH₂OH
Me nBu Et OCF₃ H CH₂Ph Me tBu iPr OnPr Me CH₂CH₂Ph Et Me Ph OiPr Me COMe iPr Et Me Ph Me COOH nPr iPr Me SEt Me CONHIMS nBu nPr Et SIPr Me CONHIMS nBu nPr Et SIPr Me CONHIMS OMe H H NIHME Et NIHMS OME H NIHME Et NIHMS All OIPr Et H NIHPh Et NICOME All OIPr Et H NIHPh Et NO2 Old All All <t< td=""><td>Me iPr</td><td>H OMe</td><td></td></t<>	Me iPr	H OMe	
Me tBu IPr OnPr Me CH₂CH₂Ph Et Me Ph OIPr Me COMe IPr Et H Ph OIPr Me COOH IPr Et H Ph Me COOH Me IPr IPr Me SEt Me CONHMe CONHMe CONHMe CONHMe CONHMe IPr CONHMe IPr NHMS Me CONHMe IPr NHMS Me CONHMe IPr CONHMe IPr CONHMe IPr CHO CONHME IPr CHO	Me nPr	Me OEt	
Et Me Ph OIPr Me COMe IPr Et H Ph Me COOH nPr IPr Me SEt Me CONH nBu nPr Et SIPr Me CONHMS tBu nBu iPr NH2 Et CONHMS OME H H NHEI Et NHCOME OIPr Et H NHPh Et NO2 OPh IPr CH2OH Me IPr CHO SET H CH2NH2 Et IPr SO3H SIPr Me CH2NHME IPr IPr SO7NHME NH12 H CH2Ph H NIHMS CI NHMS CI NHME ME CH2CH2Ph H NIHMS CI NHME CH NHEI IPR OH NHME ME CH2CH2Ph H NIHMS CI NHOME CI NHOME CI NHPH COME H NIHCOME CI CI ME CONH2 H CHO Br CI Ph CONHME H SO2NHME Br ME CI NHMS ME CI NHMS BE CI NHCOME ME CI NHMS BE CI SO3H ET BF SO4H	Me nBu	Et OCF₃	
Fr Et	Me tBu	iPr OnPr	
NPT IPT Me SEt Me CONH ₂	Et Me	Ph OiPr	
NBU NPr Et SIPr Me CONHMe	iPr Et	H Ph	
The content of the	nPr iPr	Me SEt	
OMe H H NIHMe Et NHMs OEt Me H NHEt Et NHCOMe OIPT Et H NHEh Et NO2 OPh IPT CH2OH Me IPT CH0 SET IPT CH2NH2 Et IPT SO3H SIPT Me CH2NHMe IPT IPT SO3H NIH2 H CH2Ph H IPT OH NIHMe Me CH2Ph H NHCOMe CI NIHME H COMe H NHCOMe CI NIHPh H COOH H NHCOMe CI CI Me CONHME H SO3H Br CI Ph CONHME H SO3H Br CI NHMS Me OH Br CI NHMS Me OH Br CI NHMS	nBu nPr	Et SiPr	
OFT Me H NHET ET NHCOME OFT ET H NHPh ET NO2 OFT FT CH2OH ME IPT CHO SET H CH2NH2 ET IPT SO3H SIFT ME CH2NH4 IPT OH NHME ME CH2NH4 IPT OH NHME ME CH2CH2PH H NHMS CI NHPH H COME H NHCOME CI NHPH H COOH H NO2 CI CI ME CONH2 H CHO BT CI ET CONHME H SO3H BT CI PH CONHMS ME SO2NHME BT ME CI NHMS ME CI NHMS ME CI NHMS ME CI NHMS ME CI NHMS ME SO2NHME BT ME CI NHCOME ME CI NHMS BT CI SO3H ET BT SO3H	tBu nBu	iPr NH₂	
OIPT Et H NI-IPh Et NO2 OPh IPT CH2OH Me IPT CH0 SET H CH2NH2 Et IPT SO3H SIPT Me CH3NHMe IPT IPT SO3H NH2 H CH2Ph H IPT OH NHME Me CH2CH2Ph H NHCOMe CI NHME Ph COOH H NHCOMe CI NHPh H COOH H NO2 CI CI Me CONH4 H SO3H Br CI Ph CONHME H SO3H Br CI Ph CONHMS Me SO2NHME Br Me CI NHMS Me CI NHMS Me CI NHCOME Me CI NHMS Me CI NHCOME CI NHCOME CI NHMS<	OMe H	H NHMe	
OPh iPr CH2OH Me iPr CH0 SEt H CH2NH2 Et iPr SO3H SiPr Me CH3NHMe iPr iPr SO3H NH2 H CH2Ph H iPr OH NHMe Me CH2CH2Ph H NHCOMe CI NHEt Ph COMe H NHCOMe CI NHPh H COOH H NHCOMe CI CI Me CONH2 H CH0 Br CI Ph CONHMe H SO3H Br Me CI NHMS Me OH Br Me CI NHMS Me CI NHMS Me CI NHMS Me CI NHMS Me CI NHMS Me CI NHMS Me CI NHMS Me CI NHMS <t< td=""><td>QEt Me</td><td>H NHEt</td><td></td></t<>	QEt Me	H NHEt	
SET H	OiPr Et	H NHPh	
SiPr Me	OPh iPr	CH ₂ OH Me	
NH-2	SEt H	CH ₂ NH2 Et	•
NHM2 NHM2 NHM4 M6 CH ₂ CH ₂ Ph H NHM5 CI NHCOM6 CI NHPh H COOH H NO2 CI CI M6 CONH ₂ H CHO Br CI CI Ph CONHM6 H SO ₂ NHM6 Br M6 CI NHM5 M6 CI NHCOM6 M6 CI NHCOM6 M6 CI NHCOM6 M6 CI NHCOM6 M7 CI NHCOM6 M7 CI NHCOM6 M8 CI NHCOM6 CI NHCO	SiPr Me	CH₂NHMe ìPr	
NHEt Ph	NH ₂ H	CH₂Ph H	
NHPH	NHMe Me	CH ₂ CH ₂ Ph H	
CI Me CONH ₂ H CHO Br CI Et CONHME H SO ₂ H Br CI Ph CONHME Me SO ₂ NHME Br Me CI NHMS Me OH Br Et CI NHCOME ME CI NHCOME Ph CI NO ₂ Me CI NHCOME Br Me CHO Et CI NO ₂ Me Br CON ₂ H Et Br CHO Me Br SO ₂ NHME Et Br SO ₃ H	NHEt Ph		
CI Et CONI-IME H SO3H Br CI Ph CONI-IMS ME SO2NHME Br ME CI NHMS ME OH Br Et CI NHCOME ME CI NHMS Ph CI NO2 ME CI NHCOME Br ME CHO Et CI NO2 Br CI SO3H Et Br CHO ME Br SO2NHME Et Br SO3H	NHPh H	соон Н	
CI Ph CONHMs Me SO ₂ NHMe Br Me CI NHMS Me OH Br Et CI NHCOMe Me CI NHMS Ph CI NO ₂ Me CI NHCOME Br Me CHO Et CI NO ₂ Br CI SO ₃ H Et Br CHO Me Br SO ₂ NHMe Et Br SO ₃ H	CI Me	CONH₂ H	
Me CI NHMS Me OH Br Et CI NHCOMe Me CI NHMS Ph CI NO2 Me CI NHCOMe Br Me CHO Et CI NO2 Br CI SO3H Et Br CHO Me Br SO2NHMe Et Br SO3H	CI Et	CONHMe H	
Et CI NHCOMe Me CI NHMS Ph CI NO2 Me CI NHCOMe Br Me CHO Et CI NC2 Br CI SO3H Et Br CHO Me Br SO2NHMe Et Br SO3H	Cl Ph	CONHMs Me	·
Ph Cl NO2 Me Cl NHCOMe Br Me CHO Et Cl NQ2 Br Cl SO3H Et Br CHO Me Br SO2NHMe Et Br SO3H	Me Cl	NHMs Me	
Br Me CHO Et Cl NO₂ Br Cl SO₃H Et Br CHO Me Br SO₂NHMe Et Br SO₃H	Et Ci	NHCOMe Me	
Br Cl SO₃H Et Br CHO Me Br SO₂NHMe Et Br SO₃H	Ph Cl	NO ₂ Me	
Me Br SO ₂ NHMe Et Br SO ₃ H	Br Me		
100	Br Cl		
CI Br OH Et Br SO ₂ NHMe	Me Br	002.00	
	CI Br	OH Et	Br SO₂NHMe

【0286】 【表118】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴
Н —	ОН	H CH ₂ OH
н	OMe	H CH₂NH2
Me	OEt	H CH₂NHMe
Et	OCF ₃	H CH₂Pħ
iPr	OnPr	Me CH ₂ CH ₂ Ph
Ph	OiPr	Me COMe
н	₽h	Me COOH
Me	SEt	Me CONH ₂
Et	SiPr	Me CONHMe
iPr	NH_2	Et CONHMs
Н	NHMe	Et NHMs
н	NHEt	Et NHCOMe
н	NHPh	Et NO ₂
CH ₂ OH	Me	iPr CHO
CH ₂ NH2	Et	iPr SO₃H
CH ₂ NHMe	i Pr	iPr SO₂NHMe
CH₂Ph	Н	iPr OH
CH ₂ CH ₂ Ph	Н	NHMs CI
COMe	Н	NHCOMe CI
COOH	Н	NO ₂ CI
CONH ₂	н	CHO Br
CONHMe	Н	SO₃H Br
CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
NHMs	Me	OH Br
NHCOMe	Me	CI NHMs
NO ₂	Me	CI NHCOMe
CHO	Et	CI NO ₂
SO₃H	Et	Br CHO
SO ₂ NHMe	Et	Br SO₃H
он	Et	Br SO ₂ NHMe
	H H Me Et iPr Ph H Me Et iPr H H CH ₂ NHMe CH ₂ Ph CCMe COMH COMH CONH ₂ CONHMe CONHMS NHCOMe NO ₂ CH ₃ NHMe NO ₃ CH ₃ NHMe	H OH H OMe Me OEE EE OCF3 iPr OnPr Ph OiPr H Ph Me SEL EE SIPr IPr NH2 H NHEE H NHEE H NHEE H NHPh CH2NH2 EE CH3NHMe HCH2NH2 CH4NHMe HCH2NH2 CH4NHMe HCONHMS ME NHMS ME NHMS ME NHMS ME NHOOME NO2 CH0 SO3H EE SO3H EE SO3NHME EE

[0287]

【表119】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹³	R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴
Me	Et	Н	ОН	H CH₂OH
Me	iPr	Н	QMe	H CH₂NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Et	OCF ₃	H CH₂Ph
Me	tBu	iPr	OnPr	Me CH ₂ CH ₂ Ph
Et	Me	Ph	OiPr	Me COMe
iPr	Et	н	Ph	Me COOH
nPr	iPr	Me	SEt	Me CONH ₂
nBu	nPr	Et	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	1Pr	NH ₂	Et CONHMs
OMe	Н	Н	NHMe	Et NHMs
OEt	Me	H	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	Н	NHPh	Et NO ₂
OPh	iPr	CH ₂ OH	Me	iPr CHO
SEt	н	CH ₂ NH2	Et	iPr SO₃H
SıPr	Me	CH ₂ NHMe	iPr	iPr SO₂NHMe
NH ₂	н	CH₂Ph	н	iPr OH
NHMe	Me	CH2CH2Ph	Н	NHMs CI
NHEt	Ph	COMe	н	NHCOMe CI
NHPh	Н	COOH	Н	NO₂ CI
CI	Me	CONH ₂	Н	CHO Br
a	Et	CONHMe	н	so₃H Br
CI	Ph	CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	CI	NHCOMe	Me	CI NHMs
Ph	CI	NO ₂	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO ₂
Br	Cl	SO ₃ H	Et	Br CHO
Me	Br	SO ₂ NHMe	Et	Br SO₃H
CI	Br	ОН	Et	Br SO₂NHMe
		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		

【0288】 【表120】

R ¹³ R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴
Me Et	н он	H CH₂OH
Me iPr	H OMe	H CH₂NH2
Me nPr	Me OEt	H CH₂NHMe
Me nBu	Et OCF3	H CH ₂ Ph
Me tBu	ıPr OnPr	Me CH ₂ CH ₂ Ph
Et Me	Ph OiPr	Me COMe
iPr Et	H Ph	ме соон
nPr iPr	Me SEt	Me CONH ₂
nBu nPr	Et SiPr	Me CONHMe
tBu nBu	iPr NH ₂	Et CONHMs
OMe H	H NHMe	Et NHMs
OEt Me	H NHEt	Et NHCOMe
OiPr Et	H NHPh	Et NO ₂
OPh iPr	CH ₂ OH Me	iPr CHO
SEt H	CH₂NH2 Et	iPr SO₃H
SiPr Me	CH₂NHMe iPr	iPr SO₂NHMe
NH ₂ H	CH₂Ph H	iPr OH
NHMe Me	CH ₂ CH ₂ Ph H	NHMs CI
NHEt Ph	COMe H	NHCOMe CI
NHPh H	COOH H	NO ₂ CI
CI Me	CONH ₂ H	CHO Br
a Et	CONHMe H	sO₃H Br
CI Ph	CONHMs Me	SO ₂ NHMe Br
Me CI	NHMs Me	OH Br
Et CI	NHCOMe Me	CI NHMs
Ph Cl	NO ₂ Me	CI NHCOMe
Br Me	CHO Et	CI NO ₂
Br Cl	SO₃H Et	Br CHO
Me Br	SO₂NHMe Et	Br SO₃H
Cl Br	OH Et	Br SO ₂ NHMe

【表121】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹³	R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴
Me	Et	Н	OH	H CH₂OH
Me	iPr	Н	OMe	H CH₂NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Et	OCF ₃	H CH₂Ph
Me	tBu	iPr	OnPr	Me CH ₂ CH ₂ Ph
Et	Me	Ph	OiPr	Me COMe
iPr	Et	Н	Ph	Me COOH
nPr	iPr	Me	SEt	Me CONH ₂
пВu	nPr	€t	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	iPr	NH ₂	Et CONHMs
OMe	Н	Н	eMH/N	Et NHMs
OEt	Me	н	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	н	NHPh	Et NO ₂
OPh	iPr	CH ₂ OH	Me	iPr CHO
SEt	Н	CH ₂ NH2	Et	iPr SO₃H
SıPr	Me	CH ₂ NHMe	iPr	iPr SO₂NHMe
NH ₂	Н	CH₂Ph	Н	iPr OH
NHMe	Me	CH ₂ CH ₂ Ph	н	NHMs CI
NHEt	Ph	COMe	Н	NHCOMe CI
NHPh	Н	COOH	Н	NO₂ CI
a	Me	CONH ₂	Н	CHO Br
ci	Et	CONHMe	H	SO₃H Br
a	Ph	CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	CI	NHCOMe	Me	CI NHMs
Ph	CI	NO ₂	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO ₂
Вг	CI	so₃H	Et	Br CHO
Me	Br	SO₂NHMe	Et	Br SO₃H
a	Br	ОН	Et	Br SO₂NHMe
	0 2 0	$\overline{\Lambda}$		

【0290】 【表122】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹³	R ¹⁴	R ¹³ R ¹⁴
Me	Et	Н	ОН	H CH₂OH
Me	iPr	н	OMe	H CH₂NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Et	OCF ₃	H CH₂Ph
Me	tBu	ì₽r	OnPr	Me CH₂CH₂Ph
Et	Me	Ph	OiPr	Me COMe
iPr	Et	н	Ph	Me COOH
nPr	1Pr	Me	SEt	Me CONH ₂
nBu	nPr	Et	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	iPr	NH ₂	Et CONHMs
OMe	H	Н	NHMe	Et NHMs
OEt	Me	H	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	Н	NHPh	Et NO ₂
OPh	iPr	CH ₂ OH	Me	iPr CHO
SEt	Н	CH ₂ NH2	Et	iPr SO₃H
SiPr	Me	CH ₂ NHMe	ιPr	iPr SO₂NHMe
NH ₂	H	CH ₂ Ph	Н	iPr OH
NHMe	Me	CH2CH2Ph	н	NHMs CI
NHEt	Ph	COMe	Н	NHCOMe CI
NHPh	Н	COOH	Н	NO₂ CI
CI	Me	CONH ₂	Н	CHO Br
a	Et	CONHMe	Н	SO₃H Br
a	Ph	CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	CI	NHCOMe	Me	Cl NHMs
Ph	CI	NO ₂	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO ₂
Br	CI	SO₃H	Et	Br CHO
Me	Br	SO₂NHMe	Et	Br SO₃H
a	Br	OH	Et	Br SO₂NHMe

[0291]

【表123】

R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³
Н	Et	н	CI	Н	OMe
н	iPr	н	Br	Н	OCF ₃
н	nPr	н	NO ₂	н	OEt
н	nBu	н	CHO	н	OiPr
н	tBu	Н	so₃H	н	SMe
Me	Н	Me	CI	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF ₃
Me	Et	Me	CH ₂ OH	Me	OEt
Me	ιPr	Me	CH ₂ NH ₂	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	Н	Et	COMe	Et	NHMe
Et	Me	Et	COOH	Et	NHEt
Et	Et	Et	CONH ₂	Et	NMe ₂
i₽r	Н	iPr	CONHMe	iPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF ₃
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	₽h	NO ₂	Ph	OiPr
CH ₂ OH	H	CH ₂ OH	CHO	CH ₂ OH	SMe
CH ₂ OH	Me	CH ₂ OH	SO₃H	CH ₂ OH	OPh
CH ₂ OMe	Et	CH ₂ OMe	SO₂NHMe	CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe	Ph	CH ₂ OMe	OH	CH ₂ OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂	Н	CH2NH2	COMe	CH ₂ NH ₂	OMe
CH ₂ NH ₂	Me	CH ₂ NH ₂	COOH	CH ₂ NH ₂	QCF ₃
CH ₂ NH ₂	Et	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CH ₂ NH ₂	OEt
CH ₂ NHMe	Me	CH ₂ NHMe	CONHMe	CH₂NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH ₂ Ph	CONHMs	CH₂Ph	SMe
CH₂Ph	Et	CH₂Ph	NHMs	CH₂Ph	OPh
CH ₂ CH ₂ Ph	íPr	CH ₂ CH ₂ Ph	NO ₂	CH ₂ CH ₂ Ph	SPh
_		_			

【0292】 【表124】

R ¹¹ R	13	R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³
н г	 Et	н	Cl	Н	OMe
	Pr	н	Br	н	OCF ₃
H n	Pr	Н	NO ₂	н	OEt
H n	Bu	н	CHO	H	OiPr
H t	Bu	Н	so₃H	н	SMe
Me	Н	Me	Cl	Me	OMe
Me N	Иe	Me	Br	Me	OCF ₃
Me	Et	Me	CH ₂ OH	Me	OEt
Me i	Pr	Me	CH ₂ NH ₂	Me	SMe
Me r	ıPr	Me	CH ₂ NHMe	Me	OiPr
Me n	Bu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	Н	Et	COMe	Et	NHMe
Et 1	Иe	Et	COOH	Et	NHEt
Et	Et	Et	CONH ₂	Et	NMe ₂
iPr	Н	iPr	CONHMe	iPr	NMeEt
nPr I	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF₃
tBu I	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	Ph	NO ₂	₽h	OiPr
CH ₂ OH	н	CH ₂ OH	CHO	CH ₂ OH	SMe
CH₂OH I	Me	CH ₂ OH	so₃H	CH₂OH	OPh
CH ₂ OMe	Et	CH ₂ OMe	SO ₂ NHMe	CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe	Ph	CH ₂ OMe	OH	CH₂OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂	Н	CH ₂ NH ₂	COMe	CH ₂ NH ₂	OMe
CH ₂ NH ₂	Me	CH ₂ NH ₂	COOH	CH ₂ NH ₂	OCF ₃
CH2NH2	Et	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CH ₂ NH ₂	OEt
	Me	CH ₂ NHMe	CONHMe	CH₂NHMe	OiPr
- · · · 2· · · ·	Me	CH ₂ Ph	CONHMs	CH ₂ Ph	SMe
CH₂Ph	Et	CH ₂ Ph	NHMs	CH₂Ph	OPh
CH ₂ CH ₂ Ph	iPr	CH ₂ CH ₂ Ph	NO ₂	CH ₂ CH ₂ Ph	SPh

[0293]

【表125】

R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³
н	Et	Н	CI	Н	OMe
н	iPr	н	Br	Н	OCF ₃
Н	nPr	н	NO ₂	Н	OEt
н	nBu	н	CHO	н	OiPr
н	tBu	Н	so₃H	н	SMe
Me	н	Me	CI	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF ₃
Me	Et	Me	CH ₂ OH	Me	OEt
Me	ıPr	Me	CH ₂ NH ₂	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	н	Et	COMe	Et	NHMe
Et	Me	Et	COOH	Εt	NHEt
Et	Et	Et	CONH ₂	Εt	NMe ₂
iPr	Н	iPr	CONHMe	iPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF ₃
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	Ph	NO ₂	₽ħ	OiPr
CH ₂ OH	Н	CH ₂ OH	CHO	CH₂OH	SMe
CH ₂ OH	Me	CH ₂ OH	so₃H	CH ₂ OH	OPh
CH ₂ OMe	Et	CH ₂ OMe	SO₂NHMe	CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe	Ph	CH ₂ OMe	OH	CH ₂ OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂	Н	CH2NH2	COMe	CH ₂ NH ₂	OMe
CH ₂ NH ₂	Me	CH_2NH_2	COOH	CH ₂ NH ₂	OCF ₃
CH ₂ NH ₂	Et	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CH ₂ NH ₂	Œt
CH ₂ NHMe	Me	CH ₂ NHMe	CONHMe	CH₂NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH₂Ph	CONHMs	CH ₂ Ph	SMe
CH ₂ Ph	Et	CH₂Ph	NHMs	CH₂Ph	OPh
CH ₂ CH ₂ Pt	ı iPr	CH ₂ CH ₂ Ph	NO ₂	CH ₂ CH ₂ Ph	SPh

【0294】 【表126】

				,		
R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³		R ¹¹	R ¹³
Н	Et	н	CI		Н	OMe
H	iPr	Н	Br		Н	OCF ₃
н	nPr	Н	NO ₂		н	OEt
н	nBu	н	CHO		Н	OiPr
н	tBu	н	so₃H		Н	SMe
Me	Н	Me	Cl		Me	OMe
Me	Me	Me	Br		Me	OCF ₃
Me	Et	Me	CH ₂ OH		Me	OEt
Me	iPr	Me	CH ₂ NH ₂		Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe		Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH ₂ Ph		Me	OnPr
Et	Н	Et	COMe		Et	ИНМе
Et	Me	Et	COOH		Et	NHE
Et	Et	Et	CONH ₂		Et	NMe_2
iPr	Н	iPr	CONHMe		iPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs		nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs		nBu	OCF ₃
t⊞u	Me	tBu	NHCOMe		tBu	OEt
Ph	Ph	Ph	NO_2		Ph	OiPr
CH ₂ OH	Н	CH ₂ OH	CHO		CH ₂ OH	SMe
CH ₂ OH	Me	CH ₂ OH	SO₃H		CH ₂ OH	OPh
CH ₂ OMe	e Et	CH ₂ OMe	SO ₂ NHMe		CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe	Ph	CH ₂ OMe	OH		CH ₂ OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂	H	CH ₂ NH ₂	COMe		CH ₂ NH ₂	OMe
CH ₂ NH ₂	Me	CH ₂ NH ₂	COOH		CH ₂ NH ₂	OCF ₃
CH ₂ NH ₂	Et	CH ₂ NH ₂	CONH ₂		CH ₂ NH ₂	OEt
CH ₂ NHM	е Ме	CH ₂ NHMe			CH ₂ NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH₂Ph	CONHMs		CH₂Pħ	SMe
CH₂Ph	Εt	CH ₂ Ph	NHMs		CH ₂ Ph	OPh
CH ₂ CH ₂ F	h iPr	CH ₂ CH ₂ Ph	NO ₂		CH ₂ CH ₂ Ph	SPh

[0295]

【表127】

		K			
R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³
Н	Et	Н	CI	Н	OMe
Н	iPr	Н	Br	Н	OCF ₃
H	nPr	Н	NO_2	Н	OEt
	nBu	Н	CHO	н	OiPr
H	tBu	н	so₃H	н	SMe
Me	Н	Me	CI	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF ₃
Me	Et	Mə	CH ₂ OH	Me	OEt
Me	ìPr	Me	CH ₂ NH ₂	Me	SMe
Me	пPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH ₂ Ph	Me	OnPr
Et	Н	Et	COMe	€t	NHMe
Et	Me	Et	COOH	Et	NHEt
Et	Et	€t	CONH ₂	Et	NMe ₂
iPr	H	iPr	CONHMe	(Pr	NMeEt
nPr	Me	n₽r	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF ₃
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	Ph	NO ₂	Ph	OiPr
CH ₂ OH	H	CH ₂ OH	CHO	CH ₂ OH	SMe
CH ₂ OH	Me	CH ₂ OH	so₃H	CH ₂ OH	OPh
CH ₂ OMe	Et	CH ₂ OMe	SQ ₂ NHMe	CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe	Ph	CH ₂ OMe	OH	CH ₂ OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂	н	CH ₂ NH ₂	COMe	CH ₂ NH ₂	OMe
CH ₂ NH ₂	Me	CH ₂ NH ₂	COOH	CH ₂ NH ₂	OCF ₃
CH ₂ NH ₂	Et	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CH_2NH_2	OEt
CH ₂ NHMe	Me	CH ₂ NHMe	CONHMe	CH ₂ NHMe	OiPr
CH ₂ Ph	Me	CH ₂ Ph	CONHMs	CH₂Ph	SMe
CH ₂ Ph	Et	CH₂Ph	NHMs	CH ₂ Ph	OPh
CH2CH2Ph	iPr	CH ₂ CH ₂ Ph	NO ₂	CH ₂ CH ₂ Ph	SPh
<u> </u>	0.20	6 1			

【0296】 【表128】

	Ŕ ⁿ			
R ¹¹ R ¹³	R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³
H Et	Н	Cl	Н	OMe
H iPr	н	Br	Н	OCF ₃
H nPr	Н	NO_2	Н	OEt
H nBu	н	CHO	Н	OiPr
H tBu	н	SO₃H	Н	SMe
Me H	Me	CI	Ме	OMe
Me Me	Me	Br	Me	OCF ₃
Me Et	Me	CH ₂ OH	Me	OEt
Me iPr	Me	CH2NH2	Me	SMe
Me nPr	Me	CH ₂ NHMe	Me	OiPr
Me nBu	Me	CH ₂ Ph	Me	OnPr
Et H	Et	COMe	Et	NHMe
Et Me	Εt	COOH	Et	NHEt
Et Et	Et	CONH ₂	Et	NMe_2
ıPr H	íPr	CONHMe	iPr	NMeEt
nPr Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu Et	nBu	NHMs	nBu	OCF ₃
tBu Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph Ph	₽h	NO ₂	Ph	OiPr
CH₂OH H	CH ₂ OH	CHO	CH ₂ OH	SMe
CH ₂ OH Me	CH ₂ OH	SO₃H	CH ₂ OH	OPh
CH ₂ OMe Et	CH ₂ OMe	SÖ₂NHMe	CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe Ph	CH ₂ OMe	ОН	CH ₂ OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂ H	CH ₂ NH ₂	COMe	CH2NH2	OMe
CH ₂ NH ₂ Me	CH ₂ NH ₂	COOH	CH ₂ NH ₂	OCF ₃
CH ₂ NH ₂ Et	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CH ₂ NH ₂	OEt
CH₂NHMe Me	CH ₂ NHMe		CH ₂ NHMe	OiPr
CH₂Ph Me	CH ₂ Ph	CONHMs	CH ₂ Ph	SMe
CH₂Ph Et	CH ₂ Ph	NHMs	CH ₂ Ph	OPh
CH2CH2Ph iPr	CH2CH2Pt	NO ₂	 CH ₂ CH ₂ Ph	SPh

[0297]

【表129】

		R.		_		
R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³	_	R ¹¹	R ¹³
Н	Et	Н	CI	-	Н	OMe
H	iPr	Н	Br		н	OCF ₃
н	nPr	н	NO ₂		н	OEt
H	nBu	н	CHO		н	OiPr
H	tBu	Н	SO₃H		Н	SMe
Me	н	Me	CI		Me	OMe
Me	Me	Me	Br		Me	OCF ₃
Me	Et	Me	CH ₂ OH		Me	OEt
Me	iPr	Me	CH ₂ NH ₂		Me	SMe
Me	nPr	Me	CH ₂ NHMe		Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH ₂ Ph		Me	OnPr
Et	Н	Εt	COMe		Εt	NHMe
Et	Me	Et	COOH		Εt	NHE
Et	Et	Et	CONH ₂		Et	NMe ₂
iPr	Н	iPr	CONHMe		iPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs		nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs		nBu	OCF ₃
tBu	Me	tBu	NHCOMe		tBu	OEt
Ph	Ph	₽h	NO ₂		Ph	OiPr
CH ₂ OH	Н	CH ₂ OH	CHO		CH ₂ OH	SMe
CH ₂ OH	Me	CH ₂ OH	so₃H		CH ₂ OH	OPh
CH ₂ OMe	Et	CH ₂ OMe	SO ₂ NHMe		CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe	Ph	CH ₂ OMe	οн		CH ₂ OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂	Н	CH ₂ NH ₂	COMe		CH ₂ NH ₂	OMe
CH ₂ NH ₂	Me	CH ₂ NH ₂	COOH		CH_2NH_2	OCF ₃
CH ₂ NH ₂	Et	CH2NH2	CONH ₂		CH_2NH_2	OEt
CH ₂ NHMe		CH ₂ NHMe	CONHMe		CH ₂ NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH₂Ph	CONHMs		CH₂Ph	SMe
CH ₂ Ph	Et	CH ₂ Ph	NHMs		CH₂Ph	OPh
CH ₂ CH ₂ Ph		CH ₂ CH ₂ Ph	NO ₂	_	CH ₂ CH ₂ Ph	SPh
	0.29	8			_	

【0298】 【表130】

R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³	R ¹¹	R ¹³
— H	Et	Н	CI	Н	OMe
н	iPr	Н	Br	Н	OCF ₃
н	nPr	H	NO ₂	н	OEt
н	nBu	н	CHO	н	OiPr
н	tBu	Н	SO₃H	Н	SMe
Me	Н	Me	CI	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF ₃
Me	Et	Me	CH ₂ OH	Me	OEt
Me	ıPr	Me	CH ₂ NH ₂	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	н	Et	COMe	Et	NHMe
Et	Me	Et	COOH	Et	NHE
Et	Et	Εt	CONH ₂	Et	NMe ₂
iPr	Н	iPr	CONHMe	ıPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF ₃
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	₽ħ	NO ₂	Ph	OiPr
CH ₂ OH	Н	CH ₂ OH	CHO	CH ₂ OH	SMe
CH ₂ OH	Me	CH ₂ OH	SO₃H	CH ₂ OH	OPh
CH ₂ OMe	Et	CH ₂ OMe	SO₂NHMe	CH ₂ OMe	SPh
CH ₂ OMe	Ph	CH ₂ OMe	OH	CH ₂ OMe	NHPh
CH ₂ NH ₂	Н	CH_2NH_2	COMe	CH ₂ NH ₂	OMe
CH ₂ NH ₂	Me	CH ₂ NH ₂	COOH	CH ₂ NH ₂	OCF ₃
CH ₂ NH ₂	Et	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CH ₂ NH ₂	OEt
CH ₂ NHMe	e Me	CH₂NHMe	CONHMe	CH ₂ NHMe	OiPr
CĤ₂Ph	Me	CH₂Ph	CONHMs	CH₂Ph	SMe
CH₂Ph	Et	CH ₂ Ph	NHMs	CH ₂ Ph	OPh
CH ₂ CH ₂ PI	h iPr	CH ₂ CH ₂ Ph	NO ₂	CH ₂ CH ₂ Ph	SPh

[0299]

【表131】

HN-R			
HN~	LUIA I	ни	HN N
HN~~~	اد اا	HN \	
HN	HN F	HN	HN T
HN	HN CI		. _{F HN} ~ , , , , , ,
	HN	HN F	HN N
HN~~	HN NH:	2 HN	HN~~S~
HN	'F	Ċ	HN~~~
HN C	HN ~ F	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	LN.
HNOH	HN		HN~~N
HN	HN	HN OH	

【0300】 【表132】

HN-R		
HN-Me	HN	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
HN	\Diamond	óн
HN ∕	ни	HN HN F
HN	ни	HN HN F
HN ~~~	HN	HN HN
HN	HN	I F
ни	AN -	HN HN Ne Me
HN	HN	HN S HN
ни	HN	HN~^0
ни	HN	HN O HN
ни	HN	HN N HN S
HN OH	HN	HN O HN O

HN-R			
HN	HN NH2	ни	HN CI
HN	HOOHN	MeHN HN	HN
HN F	CO ₂ H	NHCH₂Pi	h Me N Me
HN F	HN CO ₂ M	HN	Ac DMe
HN NH ₂	H₂NOC HN	MaO ₂ SHN	HN H ₂ N
HO OH	HN NO ₂	NHSO ₂ E	th Ph
HN	HN	DNH ₂ CN	HN Me
HN OH	Me O	HN	HN
HN OH	HN OCF3	HN	HN

【0302】 【表134】

HN-R		
HN SO ₉ H	HNOEt	HN
H ₂ NO ₂ S	MeOCO HN	OMe
CH ₂ OH	NHCOOE	HN OMe
COCH₃ HN	HN OPh	HN
CI	HN OCOCH3	HN CO₂H
HN	HN OH	HN COMe
HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	OH Me	HN Br
HN	OH HN Br	HN H

	Me	
HN-R		
Me HN	HN	HN
HN N	HN	HN
ни	HN N	HN NH2
HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN NH	HNOMe
HN N	O ₂	HN
HN~N~	HN H	HNON
HN N	HN N	HN ~ O

【0304】 【表136】

HN-R			
HN~ S	ни	HN N	HN N N
HN N-N	HN	HN N	HN
N N	HN N	HN C	HN N
HN N	HN N	HN	2
N=Z	HN N CI	HN	HN
HN		2-1	HN N
AN NA	HN N	HN° V	\bigcap
HN	HN CO) HN	ни
<i>F</i> %	HN	HN N-S	
HN CO	HN S	→ HN → H	HN TH
HN	PHIN .	• •	

[0305]

【表137】

HN-R		
HN-Me	HN_	HN HN
HN-EI	HN .	HN HN
HN~~	\sim	ÓH ✓
HN \	HN	HN HN OF
ни	HN	HN HN F
ни	HN	HN HN
HN	$\sim \Omega$	l F
ни	HN~~	HN N MB
HN	HN	HN~S HN
HN	HN	HN ~ 0 .
HN	HN	HN O HN
HN	HN~	HN N HN S
HN OH	ни	HN TO HN TO
<u>.</u>		

【0306】 【表138】

[0307]

	Me	
HN-R		
HN SO ₃ H	HN OEI	HN Me
H ₂ NO ₂ S	HN HN	OMe
CH ₂ OH	NHCOOEI HN	HN OMe
COCH ₃	HN	HN OM6
ÇI	HN OCOCH3	HN NO ₂
HN C1	HN	HN COMe
HN CC	HN OH Me	HN Br
HN	OH Br	HN

【0308】 【表140】

HN-R		
HN	ни	HN
HN N	HN	HN
HN	HN N	HN NH2
HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HN OMe
HNON	OH OH	HNOOH
HN N	HN H	HN~N
HN N	HN N	HN O
HN N	HN	HN NH ₂
HN O	HN ~ N	HN CI

【表141】

	Me	es c	
HN-R			
HN~ LS	HM N	HN N	HN N N
HN N-N	HM N	HN~N°	HN N
HN~N	HN N	HN~	HN
HN N	HN N	HN S	HN-
HN N CI	HN N CI	HN N NH	ни
HN N		o-S	HN N
HN N	HIN JO	HN TH	ни
HN \	HN H		HN
HN S	HN S	⊢ HN \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\	HN TH

【0310】 【表142】

HN-R		
HN -Me	HN_	HN HN
ниЕ:	HN .	HN HN
HN ~	\bigcirc	ÓН
ни∼▽	HN	HN HN F
ни	HN	HN HN C
ни	ни	HN HN
HN \	HN	Me O
HN		HN HN N
HN	HN~	HN~S~
ни	HN	HN~~°
HN~~	HN	HN O HN
HN	HN	HN N HN S
HN OH	HN	HN CO HN CO
HN O		

[0311]

HN-R			
HN~	HN NH2	HN	Me HN CI
HN F	HOOHN	MeHN HN	HN CI
HN	CO₂H HN	NHCH₂F	h Me-N-Me
HN F	HN CO₂M	e HN NH	HN OME
HN NH2	H ₂ NOC HN	Me O ₂ SHN	H ₂ N
HO OH	HN NO ₂	NHSO ₂ E	et Ph
HN \	HN	DNH ₂ CN	HN Me
ни	HN Me O	HN	HN
HN OH	OCF ₃	HN	HN

【0312】 【表144】

HN-R		
HN SO₃H	HN OEt	HN Me
H ₂ NO ₂ S	Me OCO	OMe -
CH2OH	NHCOOE!	HN OMe
cocH₃ HN	HN	HN OMe
····	HN OCOCH3	HN CO₂H
HN CI	HN CH	HN COMe
HN CCO	OH Me	HN NHC OPF
HN	OH Br	HN H

HN⊸R		
HN Me	ни	HN
HN-N	HN	HN
HN	HN N N	HN NH2
HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN Me-s-NH	HN OMe
HN N	OH OH	HN
HN N	HN H	HN~N
HN N	HN N	HN
HN N	HN	HN NH ₂
HN O	HN N	HIN CI

【0314】 【表146】

HN-R			
HN S	HN	NO NO	HN N N
HN N-N	HN	HN	HN
HN~N	HN N	HN C	HN~\N
HN N	HN N N	HN	
HN N CI	HN N CI	HN N NH	HN
, n-1		HN OF TO	HN N
HN~N	HN	,	
HN N	HN O] HN	HN N
HN	HN N	, HN N-8	HN JN J
HN \\	HN	→ HN \\	HN TH
[03	3 1 5]		

【表147】

HN-R		
Ни-ме	HN_A	HN HN
HN-Et	HN 💭	HN HN
HN	····	он ∨
HN \	ни	HN HN
ни	HN	HN HN DF
HN ~~~	ни	HN HN
HN ~	HN \	···· *
HN ~	AN -	HN N N N
ни	ни	HN~S
HN~~~	HN \	HN ~ 0 .
HN	HN	HN O HN
HN	HN N	HN NH HN S
HN OH	HN	HN TO HN TO

【0316】 【表148】

HN-R			
HN F	HN NH2	HN	HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN	CO₂H HN	NHCH ₂ i	Ph Me N-Me
HN F	HN CO ₂ M	HN N	HN O
HN NH2	H ₂ NOC	Me O ₂ SHN	H ₂ N
HO OH	HN NO2	NHSO₂I	HN Ph
HN	HN	DNH ₂ CN	HN~M
HN OH	Me O	HN	HN
HNOH	HN OCF3	HN	HN

HN-R		
HN SO ₃ H	HN OEt	HN
H ₂ NO ₂ S	HN MeOCO	OMe
CH2OH	NHCOOE!	HN OMe
COCH₃	HN OPh	HNOMe
HN CI	HN COCOCH₃	HN NO ₂
HN CI	HN OH	HN COMe
HN S	OH Me	HN Br
HN O	OH Br	
HN	HN	HN

【0318】 【表150】

HN-R		
HN Me	HN	HN
HN N	HN	HN
HN	HN N	HN NH ₂
ни	HN NH2	HN NHMe
HNOH	HN Me-s-NH	HNOMe
HN N N	OH OH	HN
HN~N	HN H	HNON
HN N	HN N	HN O
HN N	HN \	HN NH ₂
HN O	HN N	HN CI

	Me	0	
HN-R			
HN S	HN N	HN N	HN N N
HN N-N	HN N	HN NO	HN
N= N= N= N= N= N= N= N= N= N= N= N= N= N	HN N	HN O	HN
HN N	HN~N	HN	2
HN N CI	HN N CI	HN N NH	HN
CN CN	N I	-N-	HN N
HN	HN N) HN	HN
HN N	HN N	N-S	
HN	HN H		HN N
HN	HN S	- HN TH	HNJÜ
	2 2 0		

【0320】 【表152】

HN-R		
HN-Me	ни	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
HN ~~		ОН
HN \	ни	HN HN
HN \	HN \	HN HN F
ни	HN	HN HN
HN \	HN \	Me ✓
ни	\bigcirc	HN N HN N
HN~	HN	HN~S HN
ни	HN	HN ~ O .
HN	HN	HN O HN
ни	HN	HN N HN S
HN OH	HN	HN O HN O

[0321]

	Me		
HN-R			
HN	HN NH ₂	HN	Me HN CI
HN F	HOOHN	MeHN HN	HN CI
HN F	CO₂H HN	NHCH₂P	h Me N-Me
HN F	HN CO ₂ Me	HN NH	AC HN ON
HN NH ₂	H ₂ NOC	Me O₂SHN HN	HN H ₂ N
HNOOH	HN NO2	NHSO₂E	t Ph
HN	HN NHCO	NH ₂ CN	HN
HN	Me O HN	HN	HN
HN OH OH	OCF3	HN	HN

【0322】 【表154】

HN-R		
HN SO ₃ H	HNOEI	HN Me
H ₂ NO ₂ S	MeOCO HN	OMe
CH₂OH	NHCOOEt HN	HN OMe
COCH³	HN	HNOMe
ÇI	HN OCOCH3	HN CO ₂ H
HN CI	HN OH	HN COMe
HN S	OH Me	HN NHC OP
HN O	OH Br	
HN	HN	HN H

HN-R Me HN			
HN H	HN-R		
HN H	1 1 1	HN	HN
HN H	HN N	HN	
HN NH2 HN NHMe HN NHMe HN NHMe OH HN NHME HN OH HN NHME HN	HN	HN~~N	Y E N
HN N HN N HN N HN N HN N HN N L	HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN N HN N HN N HN N HN N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	HN OH	HN Ne-S-NH	
HN N HN N HN N HN N N HN N N N N N N N	HN~Ņ	OH	
HN NH2 HN NH2 HN CI		HN~	HN
HN NH2	HN N	HN	HN
HN N HN CI		HN	11 .1
HN CI	HN~~0	HN	CI
	HN ~ 0 ~ 1 ~ 1		CI

【0324】 【表156】

HN-R			
HN S	HN	HN N	HN N
HN N-N	HN N	HN NO	HN N
HN N	HN N	HN	HN
HN N	HN N N	HN	HNL
HN N CI	HN N CI	HN N NH	HN
N	Ö	HN O	HN N
HN N	HN	, F ^N	CN CNH
HN	HN O) HN	
HN	HN N	HN N-S	HN N
HN \ S	HN	> HN TH) HN TH

[0325]

HN-R			
HN ~	ни	HN ~	ни
HN~~	HN	HN	HN N N
HN	F	HN ~	
HN	HN	HN \	F HN O
HN	HN	½	HN S
HN	HN	HN	HN ~~~
HN	HN	ни соон	HN
HN~	HNOH	HN NH2	HN
ни	HN	HN	HN
ни		HN Me	HN N -CI
HN	HN \	HN	N N
HN OH	HN	HNOH	Ü

【0326】 【表158】

HN-R			
HN ~~	ни ОН	ни	ни
HN		ни	
HN \	HN	HN ~ (~)	8
HN	HN~\		F HN ~ N
\cap	HN	HN F	HN N
HN	ſ~Ţ ^{NI}	H ₂	HN~~S~
ни	HN E.	HN	HN~~0~
HN	HN	HN COOH	HN O
HN	HN	HN \	HN
\bigcap	OH HN	HN NH2	HN
HN \	HIV J	HN Me	N CI
ни	HN	HN	HN
HN OH	HN		HN~N
HN	HN	HNOH	

【表159】

HN-R			
HN ~	ни	HN~~	HN
HN ~	о́н 	HN \	HN N N
HN	HN	HN~~	
HN	HN		·F HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
\Box	HN	HN F	HN~N~
HN	N	HN	HN~~S~
HN	HN F	f	HN ~~ °
HN \	HN	HN COOH	HN
HN	HN	.F	HN
····	óн	NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	N CI
ни	HN	HN	HN N
HN OH	HN \		HN N
HN	HN~	HNOH	

【0328】 【表160】

HN-R			
ни~	HN OH	IN \\	HN N
HN		HN O	HN
HN		ни	
HN	HN	HN \	F HN O
HN	HN NH ₂	V F	HN S
HN ~	HN	HN	HN~~O~
HN \	HN F	HN COOH	HN~°
	HN	HN	HN
HN ~	ОН	ŃH₂	HN
HN	HN	HN HN Me	N=>-CI
HN	HN	HN	HN N
HN OH	HN		HN~N
HN	HN	ни он	

【表 1 6 1】

【0330】 【表162】

HN HN OH
HN-R			
HN ~	ни	ни	HN
HN		HN	
HN	HN	HN~~	
HN	HN	HN \	-F HN
HN	HN N	1 ₂	HN N
ни	HN	HN F	HN~~°
\Box	HN F	HN COOH	HN O
HN		F	
HN	HN OH	HN NH ₂	HN~~~
ни	HN	HN HN Me	HN N=\
HN	HN	HN	HN N CI
HNOH	HN		HN N
HN	HN	HN OH	

【0332】 【表164】

HN-R			
ни ~	HN OH	ни	HN N
HN		HN^	HN
HN	HN F	HN~~	, [
HN	HN	HN \	F HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN	HN	, (*)	HN S
HN	HN	HN	HN O
HN	HN	HN COOH	HN
HN ~	HN	HN \	HN
	ÓН	NH ₂	HN
HN	HN	HN Me	N → CI
HN	HN	HN	N
HNOH	HN	ни	HN~~
ни	HN	он	

HN-R			
HN ~	HN OH	HN	HN
HN	HN O	HN	HN N N C
HN	F	HN~~	
HN	HN	HN	F HN
HN	HN	√F 1 ₂	HN S
HN CO	HN E	HN F	HN~~O~
HN	HN	HN COOH	HN~°C
HN	HN~	.F HN	HN
	óH HN → □	HN \	HN N
HN		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N-J
HN OH	HN	HN	HN N
	HN	δн	

【0334】 【表166】

HN-R			
HN	ни	ни	HN
HN ~~	óн	HN O	HN N N
HN	HN F	HN~~	
HN	HN CI	HN \	F HN
HN	HN	F	HN N
HN	HN	HN F	HN~~°
\bigcap	HN F	HN COOH	HN
HN~~		F	,,,,,
HN	HN OH	HN NH ₂	HN N
HN	HN	HN HN Me	HN N=
ни	HN	HN	HN N CI
ни	HN		HN~N
ни	HN	ни	

HN-R			4.00
HN	HN OH	HN~~	ни
HN	HN O	HN	
HN	F	HN~~	i
HN	HN	HN	F HN V
HN	HN NH	U √F	HN N
HN	HN F.	2 HN F	HN O
HN	HN	ни соон	HN O
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	ни ни ме	HN
HN	HN	HN	HN N CI
HN OH	ни		HN N
HN	ни	HNOH	

【0336】 【表168】

HN -R			
HN ~~	HN ~	ни	HN NO
HN	óн	HN \	"
HN	HN F		HN JN
HN \	HN	HN \	F HN N
	HN	HN F	HN
HN	(NH	. 11 -21	HN~~S~
HN~	HN E	HN	HN~~~
HN	HN	HN COOH	HN~O
HN	HN	HN \	HN
	_{ОН}	ŇH₂	HN
HN~~~	HN	HN Me	N=\
HN	HN	HN	HN N C
HN OH	HN		HN N
ни	ни	ни	

HN-R			
ни	HN OH	ни	HN
HN ~~~		HN \	HN N N
HN	HN	HN~~	
HN	HN CI		F HN
\cap	HN	HN F	HN~NJ
HN~~	. C	H ₂	HN~~S~
HN	HN F	ł	HN ~~ 0 ~
HN	HN	HN COOH	HN O
HN CO	HN	F HN	HN
\cap	óн Он	HN NH2	HN
HN	HN	HN Me	N=>-cı
HN -	HN	HN	HN N
HN OH	HN		HN~N
HN J	HN~	HNOH	

【0338】 【表170】

HN-R			
ни	HN OH	HN \	HN N
HN ~~~		HN	
HN \	HN ~ F		HN T
HN	ни	HN	F HN
\sim	HN	HN CF	HN
HN	NF NF	. 11 -41	HN~~S~
HN	HN	HN	HN~~O~
HN	HN	ни соон	HN O
HN	HN	.F	HN
HN		HN NH2	HN
)	HN I	HŇ Me	N CI
HN	HN	HN	HN N
HN \	HN		HN~NH
ни	HN	HNOH	Ū

HN-R			
HN ~	HN OH	ни	HN
HN		ни	
HN	HN F	HN~~	i
HN	HN	HN \	F HN N
HN .	ни	L.J.	HN~N
~ ·	HN	2 HN	HN~\S\
HN	···· F	HN	HN - 0.
HN	HN ~	соон	HN
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN		HN	HN
-1		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N-J
HN OH	HN		HN~N
HN	HN \	HNOH	

【0340】 【表172】

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~~	HN N
HN	_	ни	HN N N
HN	F	HN ~~	,
HN	HN CI	HN	F HN O
HN	HN NH:	√ _F	HN S
HN	ни	, HN E	HN O
\Box	HN F	ни соон	HN O
HN~~			, , ,
HN~~	HNOH	HN NH ₂	HN N
HN~	HN J	HN HN Me	HN N
HN	HN	HN	HN
HN OH	HN		HN~N
ни	HN	HNOH	

HN-R			
HN~	HN \	HN~~	
ни	··· Он	HN \	HN
HN	HN	HN~~	HN T
HN	HN	HN \	·F HN ~ N
HN	HN NI	√_F	HN S
HN	ни	HN	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN O
HN~	HN	.F	HN
\bigcap	ÓH HN → →	ŃH₂ HM	HN
HN~~	, s	HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN	8
- 8		ОН	

【0342】 【表174】

HN -R			
HN	HN OH	HN~~	HN
HN	HN	HN	HN
HN~	HN	ни	F HN N
	HN	HN F	HN NO
HN	HN NH ₂	HN	HN~~S
HN	F	HN \	HN~~O~
HN	HN ~~~	Соон	[N]
HN	HNOH	HN NH ₂	HN ~
HN	HN	HN HN Me	HN N CI
ни	HN	HN	HN N C
HNOH	HN		HN
HN	HN	HNOH	

【表175】

HN-R			
HN	HN OH	HN~~	HN
HN ~	. 11 -1	HN)	HN N N
HN \	HN ~ F		
ни	HN~	HN	F HN N
	HN	HN F	ни
HN	NH ₂	HN	HN~~S~
HN~	HN	''''	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN~°C
HN	HN OH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N
HN	HN	HN NIE	HN N CI
ни	HN		HN N
HN	HN /	HNOH	

【0344】 【表176】

HN-R			
HN ~	HN OH	ни	HN
HN	_	HN O	HN
HN	HN	HN \	E HN N
HN		HN^Q_	HN
HN	HN NH:		HN S
HN	HN F	HN	HN~~_0~
HN	HN ~ J	ни соон	HN O
HN	HNOH	HN \	HN
HN	HN	HN NH2	HN
HN		HN. _{Me}	HN N CI
1	HN	ни	HN N
HN OH	HN	HN	ď
		UH	

HN-R			-
HN ~	HN OH	HN~~	HIN
HN	ll .l	HN C	
HN	HN F	HN \	, \rac{1}{\rac{1}{2}}
HN	HN \		F HN ~ N ~
~ 	HN	HN F	ни~_и
HN	NH ₂	HN ~	HN~~S~
ни	HN E	, I	HN~~O~
HN \	HN	HN COOH	HN
HN \	HN OH	HN NH ₂	HN
HN \	HN	HN HN. _{Me}	HN
HN	HN	HN	HN N CI
ни	HN S		EN NH
HN	HN	HN	

【0346】 【表178】

HN-R			
HN	HN OH	HN \	HN
HN	HN \	HN^C	HN
HN~	HN	HN~~	F HN N
0	HN	HN^CF	HN N
HN	HN NH2	HN	HN~S
HN ~	HN F	HN COOH	HN O
HN	I III		HN
HN	HN OH	HN NH ₂	HN
HN~~~	, HN	HN HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	Lu~uH
ни	HN	HN	8
<u> </u>			

HN-R			
ни	LIN I	HN~	HN
HN~~~	óн	HN^	
HN	HN F		HN TN
HN~	HN	HN~~	F HN N
<u> </u>		HN^Q_	HN NO
HN	HN NH;		HN S
	HN	HN	HN O
HN	F (HN \	HN~~O
HN	HN ~ F	Соон	,N,
HN	HNOH	HN	HN
\bigcap		NH ₂	
HN	HN	HN HN Me	N=>−cı
HN —	HN J	HN	HN N
HN~~~	HN		HN N
ОН	HN	HN	O
		ОН	

【0348】 【表180】

HN −R			
HN ~	HN OH	HN ~	HN
HN~~~		HN	
HN	HN ~ F	~~~~~	HN \\
HN	HN	HN	F HN
\sim	HN	HN F	HN
HN	ſ~\ ^{NH}	HN \	HN~~S~
HN	HN E	LIN F	HN~~O~
HN	HN	ни соон	HN~O
HN	HNOH	F HN	HN
HN		HN NH2	HN
HN HN	HN \	HN Me	HN N CI
HN	HN J	HN	HN N
ни	HN	HN OH	

【表181】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	н	Et	Н	NO ₂	Et
H	H	iPr	CHO	Н	ıPr	Н	CHO	iPr
н	Н	nPr	SO ₃ H	н	nPr	н	so₃H	nPr
H	н	nBu	ci	Н	nBu	Н	CI	nBu
н	н	tBu	Br	H	tBu	н	Br	tBu
Н	н	Ph	CH ₂ OH	н	Ph	Н	CH ₂ OH	
Et	H	Н	CH ₂ NH ₂	н	Н	н	CH ₂ NH	
iPr	н	н	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHM	
nPr	Н	н	CH ₂ Ph	H	Н	Н	CH ₂ Ph	
nBu	Н	н	COMe	Н	Н	н	COMe	Н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	
Ph	н	н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH	
н	Et	Н	CONHMe	Et	Н	Εt	CONHM	
H	ıPr	н	CONHMs	iPr	н	1Pr		
H	nPr	н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	н	nBu	NHCOM	
H	tBu	н	NO ₂	tBu	н	tBu	NO ₂	Н
н	Ph	н	CHŌ	Ph	н	Ph	н	so₃H
CI	Et	н	SO ₃ H	Et	Н	Et	н	SO ₂ NHM
CI	nPr	н	SO ₂ NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
Cl	Ph	Н	OH.	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Et	Cl	Н	COMe	a	Н	CI	a	COOH
nPr	ā	н	COOH	a	Н	CI	a	CONH ₂
Ph	Cl	Н	CONH ₂	CI	Н	CI	Cl	CONHM
н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Εt	Н	CONHM
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	n₽r	Н	NHMs
H	Ph	CI	NHMs	₽h	a	Ph	Н	NO_2
Me	Me	н	NO ₂	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	н	ОНÎ	Et	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	n₽r	Н	COOH
Ph	Ph	н	COOH	Ph	Н	Ph	H	NO ₂

【0350】 【表182】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R14	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
Н	Н	iPr	CHO	Н	iPr	н	CHO	iPr
н	Н	nPr	so₃H	н	n₽r	н	SO₃H	nPr
н	Н	nBu	a	н	nB⊔	н	Cl	nBu
н	Н	tBu	Br	н	tBu	Н	Br	tBu
Н	н	₽h	CH ₂ OH	н	₽ħ	Н	CH ₂ OH	
Et	Н	Н	CH ₂ NH ₂	н	н	Н	CH ₂ NH ₂	
iPr	н	Н	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHM	
nPr	Н	Н	CH ₂ Ph	Н	Н	Н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	н	COMe	Н	Н	н	COMe	н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	н	COOH	H
Ph	н	Н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH ₂	
н	Et	н	CONHMe	£t	н	Et	CONHM	
Н	íPr	Н	CONHMs	1Pr	Н	iPr	CONHM	
н	nPr	н	NHMs	nPr	н	nPr	ИНМs	Н
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO ₂	tBu	H	tBu	NO_2	н
н	Ph	н	CHO	Ph	н	₽ħ	Н	SO₃H
CI	Et	н	so₃H	Εt	Н	Et	Н	SO ₂ NHMe
CI	nPr	н	SO₂NHMe	nPr	н	nPr	H	OH
ĊĬ	Ph	Н	OH	Ph	Н	Ph	н	COMe
Ēt	CI	н	COMe	Cl	н	CI	CI	COOH
nPr	CI	Н	COOH	CI	н	a	CI	CONH ₂
Ph	а	н	CONH ₂	CI	н	a	CI	CONHMe
н	Et	a	CONHMe	Et	CI	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
H	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	Ph	Н	NO_2
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	н	он	Et	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	н	COOH	Ph	н	Ph	Н	NO_2
					_			

【表183】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	н	Et	Н	NO ₂	Et
н	н	ıPr	CHŌ	Н	ıPr	н	CHO	iPr
н	н	nPr	so₃H	н	nPr	Н	SO₃H	nPr
H	Н	nBu	ci	н	nBu	Н	Cl	ηBu
Н	н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
Н	Н	Ph	CH ₂ OH	Н	₽ħ	Н	CH ₂ OH	₽h
Et	Н	Н	CH ₂ NH ₂	Н	н	н	CH ₂ NH ₂	
iPr	Н	Н	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHM	
nPr	Н	н	CH₂Ph	н	Н	Н	CH₂Pħ	Н
nBu	Н	Н	COMe	н	н	н	COMe	Н
tBu	Н	н	COOH	Н	Н	н	COOH	н
₽ħ	Н	Н	CONH ₂	Н	н	н	CONH ₂	
н	Et	н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
Н	iPr	Н	CONHMs	i₽r	Н	ΙPr	CONHM	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	н	лBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO ₂	tBu	Н	tBu	NO ₂	Н
H	₽h	Н	CHO	Ph	Н	Ph	Н	SO₃H
CI	Et	Н	SO₃H	Εt	Н	Et	Н	SO ₂ NHMe
Cl	nPr	н	SO ₂ NHMe	nPr	Н	nPr	н	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	Н	Ph	H	COMe
Et	CI	Н	COMe	Cl	н	CI	CI	COOH
nPr	a	Н	COOH	a	Н	CI	a	CONH ₂
Ph	a	Н	CONH ₂	Cl	Н	CI	a	CONHMe
н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	H H	NHMs
Н	Ph	CI	NHMs	Ph	a	Ph	Н	NO₂ OH
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	Me	H	
Et	Εt	н	OH	Et	Н	Et	Н	COMe COOH
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	н	nPr	H	
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph		NO ₂

【0352】 【表184】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	н	Et	Н	NO ₂	Et
Н	Н	iPr	CHO	н	iPr	Н	CHO	ìPr
Н	Н	nPr	SO₃H	н	nPr	Н	SO₃H	nPr
Н	Н	nBu	Cl	Н	nBu	H	CI	nBu
н	Н	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
Н	Н	₽h	CH ₂ OH	Н	₽h	Н	CH ₂ OH	
Et	н	н	CH ₂ NH ₂	Н	Н	Н	CH ₂ NH ₃	
iPr	Н	Н	CH ₂ NHMe	н	Н	н	CH ₂ NHM	
nPr	н	Н	CH ₂ Ph	Н	Н	н	CH_2Ph	н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	Н
Ph	Н	Н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH;	
Н	Et	Н	CONHMe	Et	Н	Εt	CONHM	
н	iPr	н	CONHMs	ıPr	Н	iPr	CONHIV	
н	nPr	н	NHMs	nPr	Н	n₽r	NHMs	н
н	nBu	н	NHCOMe	nBu	н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO ₂	tBu	Н	t₿u	NO ₂	н
Н	Ph	н	CHO	₽h	Н	₽ħ	н	SO₃H
CI	Et	Н	SO₃H	Εt	Н	Et	Н	SO ₂ NHM
CI	n₽r	н	SO₂NHMe	n₽r	Н	n₽r	Н	OH
CI	Ph	Н	он	Ph	H	Ph	н	COMe
Et	CI	Н	COMe	CI	Н	a	CI	COOH
nPr	Ci	Н	COOH	a	Н	a	a	CONH ₂
Ph	CI	Н	CONH ₂	CI	Н	Cl	CI	CONHM
Н	Et	CI	CONHMe	Εt	Cl	Et	Н	CONHM
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
Н	Ph	a	NHMs	Ph	Cl	Ph	н	NO ₂
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	Me	Н	οн
Εt	Et	Н	OH	Et	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	Н	nPr	н	COOH
Ph	Ph	н	COOH	₽h	Н	Ph	Н	NO ₂

[0353]

【表185】

R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
н	iPr	CHŌ	н	iPr	н	CHO	iPr
Н	nPr	SO ₃ H	н	nPr	Н	so₃H	nPr
Н	nBu	a	н	nBu	Н		nBu
н	tBu	Br	н	tBu	Н		tBu
Н	Ph	CH ₂ OH	Н	Ph			
н	н	CH ₂ NH ₂	Н	Н	н		
Н	н	CH₂NHMe	Н	Н	Н		
Н	Н	CH ₂ Ph	Н	Н			Н
Н	Н	COMe	н	Н			Н
Н	H	COOH	Н				
н	Н	CONH ₂	Н				
Et	Н	CONHMe	Et				
iPr	Н	CONHMs	iPr	н			
nPr	н	NHMs	nPr	н	nPr		Н
nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu		
tBu	н	NO ₂	tBu				Н
Ph	н	CHO					SO ₃ H
Et	н	SO₃H					SO ₂ NHM
nPr	Н	SO ₂ NHMe					OH
Ph	н	он	₽ħ				COMe
CI	Н	COMe					COOH
CI	Н	COOH					CONH ₂
CI	Н	CONH ₂					CONHM
Et	a	CONHMe	Et				CONHM
n₽r	CI	CONHMs	nPr				NHMs
Ph	CI	NHMs	Ph				NO ₂
Me	Н	NO_2	Me	Н	Me		ОН
Et	Н	он	Εt	Н			COMe
nPr	Н	COMe	nPr				COOH
Ph	н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO ₂
	нининининине е е е е е е е е е е е е е е	ш р р в д в н н н н н н н н н н н н н н н н н	H Et NO2 H iPr CHO H nPr SO3H H nBu Cl H tBu Br H Ph CH2OH H H CH2NH2 H H CH2Ph H H COMB H H CONHMS NPr H CONHMS NPr H NHMS NBU H NO2 Et H SO3H NPr H COMB Et H COMB Et H SO3H NPr H COMB Et H COMB	H Et NO₂ H H iPr CHO H H nPr SO₃H H H nBu CI H H tBu Br H H CH₂NH₂ H H CH₂NHMe H H CH₂NHMe H H COMH Et IPr H CONHMS nPr nPr H NHMS nPr nBu H NO₂ tBu Ph H COMH CC CI H COMH Ph CI H COMH Ph CI H COMH Ph CI H COMH Ph CH COMH R CH COMH CC CI COMH R CH COMH CC CI COMH CC CI COMH R CH COMH CC CI CI CI COMH CC CI	H Et NO2 H Et H iPr CHO H iPr H nPr SO3H H nPr SO3H H nPr H iBu Br H iBu H CH2NH2 H H H CH2NHM H H H CH2NHM H H H CH2NHM Et H H CONHM IPr H CONHM IPr H NHM IPr H SO3H Et H IPr H CONH IPr H IPr H SO3H Et H IPr H CONH IPr H IPr H SO3H Et H IPr H CONH IPr	H Et NO2 H Et H H Pr CHO H Pr H H Pr SO3H H PP H H PR SO3H H PP H H BU CI H BU H H BU Br H BU H H PR CH2OH H PR H H CH2NH0 H H H H CH2NH0 H H H H CH2PR H H H H COMH H H H H COMH H H H H CONH1 H PR H H H CONH10 ET H ET PR H CONHMS PR H BU BR H BU BR H BU BR H BU BR H BU H H COMH H H H H CONH0 BU H BU BR H BR	H Et NO2 H Et H NO2 H Pr H CHO H Pr CHO H Pr H Pr H CHO H Pr H Pr H CH2NH; Pr H Pr H CH2NH; Pr H Pr H CH2NH; Pr H Pr H CONHMS Pr H Pr H Pr H CONHMS Pr H Pr

【0354】 【表186】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	Н	Et	NO ₂	н	Et	н	NO ₂	Et
Н	Н	i₽r	CHO	Н	iPr	н	CHO	iPr
Н	н	nPr	SO₃H	Н	nPr	н	so₃H	nPr
H	н	nBu	a	Н	nBu	Н	a	nBu
Н	Н	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
H	н	Ph	CH ₂ OH	н	Ph	Н	CH ₂ OH	
Et	Н	н	CH ₂ NH ₂	н	н	Н	CH ₂ NH:	
i₽r	н	Н	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHN	
nPr	н	Н	CH₂Ph	Н	H	Н	CH₂Ph	
nBu	н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	н	COOH	
Ph	Н	н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH ₂	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Εt	CONHM	
н	iPr	Н	CONHMs	i₽r	н	iPr	CONHM	
Н	nPr	н	NHMs	n₽r	Н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
н	tBu	н	NO ₂	tBu	н	t₿u	NO_2	Н
Н	Ph	н	CHO	Ph	Н	Ph	H	SO₃H
CI	Et	н	SO₃H	Εt	н	Et	Н	SO ₂ NHMe
Cl	nPr	Н	SO ₂ NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	ОН	Ph	Н	Ph	н	COMe
Εt	Cl	Н	COMe	CI	н	CI	Cl	COOH
nPr	CI	Н	COOH	а	н	a	CI	CONH ₂
Ph	CI	Н	CONH ₂	CI	H	CI	CI	CONHWe
Н	Et	CI	CONHMe	Εt	CI	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
н	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	Ph	Н	NO ₂
Me	Me	н	NO ₂	Me	н	Me	Н	он
Et	Et	Н	он	Et	H	Et	н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO ₂

【表187】

				IVIE				
R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
Н	н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
H	н	iPr	CHÔ	н	iPr	Н	CHO	iPr
н	Н	nPr	SO ₃ H	н	nPr	н	SO₃H	nPr
H	Н	nBu	СĬ	Н	nBu	н	Cl	nBu
H	н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
H	Н	Ph	CH ₂ OH	н	Ph	н	CH ₂ OH	
Et	н	Н	CH ₂ NH ₂	Н	н	Н	CH ₂ NH ₂	
iPr	H	н	CH₂ÑHMe	Н	н	Н	CH ₂ NHM	
nPr	н	Н	CH₂Ph	Н	Н	н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	н	COMe	Н	Н	Н	COMe	н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	н	COOH	
Ph	Н	н	CONH ₂	н	Н	Н	CONH ₂	
н	Et	н	CONHMe	Εt	н	Et	CONHM	
н	iPr	н	CONHMs	i₽r	н	iPr	CONHIV	
н	nPr	н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	н
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBน	NHCOM	
Н	tBu	н	NO ₂	tBu	н	tBu	NO ₂	н
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	₽h	Н	SO₃H
Cl	Et	Н	so₃H	Et	Н	Et	Н	SO ₂ NHMe
CI	nPr	н	SO ₂ NHMe	nPr	н	n₽r	Н	OH
Cl	Ph	Н	OH	Ph	н	Ph	н	COMe
Εt	CI	н	COMe	a	н	Cl	a	COOH
nPr	CI	н	COOH	a	Н	а	CI	CONH ₂
Ph	CI	Н	CONH ₂	a	Н	Cl	a	CONHMe
Н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Et	н	CONHMs
Н	n₽r	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
Н	Ph	a	NHMs	₽h	CI	Ph	Н	NO ₂
Me	Me	н	NO ₂	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	он	Et	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph_	<u>н</u>	Ph	Н	NO ₂

【0356】 【表188】

R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵
н	Н	Et	NO ₂	Н	Et	Н	NO ₂	Et
H	н	iPr	CHŌ	Н	iPr	Н	CHO	ıPr
н	н	nPr	SO ₃ H	Н	nPr	н	SO₃H	nPr
н	Н	nBu	a	Н	nBu	Н	CI	nBu
н	н	tBu	Br	н	tBu	Н	Br	tBu
H	Н	Ph	CH ₂ OH	Н	₽h	Н	CH₂OH	
Et	н	н	CH ₂ NH ₂	Н	Н	н	CH2NH2	
iPr	н	н	CH ₂ NHMe	Н	Н	Н	CH ₂ NHM	
nPr	н	н	CH₂Ph	н	Н	н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	н	COMe	Н	Н	н	COMe	Н
tBu	H	H	COOH	Н	н	Н	COOH	
Ph	н	Н	CONH ₂	Н	Н	Н	CONH ₂	
Н	Et	н	CONHMe	Et	н	Et	CONHM	
н	îPr	Н	CONHMs	iPr	Н	1Pr	CONHM	
H	nPr	н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	н	nBu		
н	tBu	н	NO ₂	tBu	Н	t₿u	NO ₂	Н
н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	₽h	н	SO ₃ H
CI	Et	н	SO₃H	Et	Н	Et	н	SO ₂ NHMe
CI	nPr	Н	SO ₂ NHMe	nPr	н	nPr		он
CI	Ph	Н	ОН	Ph	Н	₽ħ	Н	COMe
Et	CI	Н	COMe	Cl	н	CI	a	COOH
nPr	CI	Н	COOH	a	Н	Cl	а	CONH ₂
Ph	CI	Н	CONH ₂	CI	Н	Cl	а	CONHMe
н	Et	CI	CONHMe	Εt	CI	Et	н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPi		NHMs
н	Ph	Cl	NHMs	₽h	CI	Ph		NO ₂
Me	Me	Н	NO ₂	Me	Н	Me		OH
Et	Et	Н	OH	Et	Н	Et		COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nΡ		COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph ——	н	NO ₂

【表189】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н —	н	Et	Н	NO ₂	н	Н	Н	NO ₂
н	н	iPr	Н	CHÔ	Н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	Н	SO ₃ H	н	н	Н	SO₃H
H	н	nBu	н	ci	н	н	н	Cl
н	н	tBu	Н	Br	Н	н	H	Br
Me	н	н	Me	CH ₂ OH	Н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Εt	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н	Me	н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н	Et	Н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	ıPr	Et	ìPr	CONHMs
ıPr	H	nPr	iPr	NHMs	nPr	íPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	₽h	tBu	Ph	н
Ph	Cl	Et	Ph	SO₃H	Et	Ph	Εt	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Εt	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	Ci	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	n₽r	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH₂NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt	CH ₂ Ph	Εt	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph		Ph	CH ₂ CH ₂ Pf	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н
	7 (0 -	\circ					

【0358】 【表190】

R11	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴		R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
н	н	Et	н —	NO ₂	н		Н	н	NO ₂
H	Н	iPr	Н	CHŌ	н		Н	Н	CHO
H	н	nPr	н	so₃H	н		Н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	H	CÎ	Н		Н	Н	CI
H	Н	tBu	н	Br	Н		Н	Н	Br
Me	н	н	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н		Me	Н	CH ₂ NHM6
ме	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	н		Ме	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н		Ме	Н	COMe
Me	tBu	H	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	H		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et		Εt	Εt	CONHM
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Εt	iPr	CONHM
ıPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOM
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	₽h		tBu	Ph	Н
Ph	a	Εt	Ph	SO₃H	Εt		Ph	Et	н
CH ₂ OH	CI	n₽r	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	n₽r		CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH ₂ OM e	COOH	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH_2NH_2	Cl	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	₽h	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Ме	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	C	H ₂ NHMe	Me	H
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	COOH	Ph		H₂CH₂Ph	Ph	H

[0359]

【表191】

R ¹¹	R ¹³	R¹4	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹	11	R ¹³	R14
Н	н	Et	н	NO ₂	н	-		н	NO ₂
н	Н	ìPr	Н	CHŌ	H	۲		Н	CHO
H	Н	nPr	н	so₃H	Н	H		Н	SO₃H
H	н	nBu	н	ci	Н	H		Н	CI
H	Н	tBu	Н	Br	Н	H		Н	Br
Me	Н	н	Me	CH ₂ OH	н	М		Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	H	М		Н	CH_2NH_2
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	M		Н	CH₂NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н		le	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н		le	н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		le	Н	COOH
Εt	Ph	н	Et	CONH ₂	н		≛t	Н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et		∃t	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		≣t	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr		⊃r	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		Pr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		Bu	tBu	NO_2
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		∃u	Ph	н
Ph	CI	Et	₽h	SO₃H	Et		²h	Εt	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		₂ OH	nPr	
CH ₂ OH	a	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	Cl	CH₂OMe	COMe	Cl		OMe	Cl	Cl
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH2NH2	CONH ₂	Cl		$_{2}NH_{2}$	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		$_2NH_2$	Et	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		$_2NH_2$	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	₽h	CH ₂ NH ₂	инмs	Ph		$_{2}NH_{2}$	Ph	н
CH ₂ NHMe	Μe	Me	CH ₂ NHMe	NO_2	Me		NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		l ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		1 ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH ₂	CH ₂ Ph	Ph	Н

【0360】 【表192】

						_			
R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14		R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	н	NO ₂	Н		н	н	NO ₂
н	Н	ıPr	Н	CHŌ	Н		Н	Н	CHO
H	н	nPr	н	so₃H	Н		н	Н	so₃H
н	н	nBu	н	CĪ	Н		Н	Н	Cl
H	н	tBu	н	Br	Н		н	Н	Br
Me	н	Н	Me	CH ₂ OH	н		Me	н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	Н	Me	CH ₂ NHMe	н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н		Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н		Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н		Me	н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	н		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	îPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	Cl	Et	Ph	so₃H	€t		Ph	Εt	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	H
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	H
CH ₂ OMe	Et	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI		H ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OM e	COOH	CI		H ₂ OMe	CI	CI
CH2NH2	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Εt	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH ₂ NH ₂	Et	H
CH ₂ NH ₂	н	n₽r	CH2NH2	CONHMs	nPr		CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe		Me	С	H ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	n₽r	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	n COOH	Ph	c	H₂CH₂Ph	Ph	н
	(0	3 6	1						

【表193】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R13	R14	-	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	Н	Et	Н	NO ₂	н		Н	н	NO ₂
Ĥ	Н	ıPr	Н	CHO	Н		Н	н	CHO
H	Н	nPr	н	SO₃H	н		Н	Н	SO₃H
H	н	пВu	н	cĭ	н		Н	Н	CI
н	н	tBu	Н	Br	н		Н	Н	Br
Ме	н	н	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	íPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н		Et	Н	CONH ₂
Εt	н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Et	CONHMe
Et	н	ıPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr		ıPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		,nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et		Ph	Εt	н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI		H ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OM e	COOH	CI		H ₂ OMe	Cl	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	Cl	CH2NH2	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt		CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe		Me		H ₂ NHMe	Me	H
CH ₂ Ph	Et	Εt	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	H
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH_2Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph		Ph	CH ₂ CH ₂ PI	1 COOH	Ph	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н
		2 6	2						

【0362】 【表194】

R11 R13 R14 R11 R13 R14 R14 R13 R14 H H H H H H H H NO2 H H H H CHO H H H H CHO H H H H CHO H CH2 NH H H CH2 NH H H CH2 NH H H CH2 NH Me H CH2 NH Me H CH2 NH Me H CH2 NH Me H									
H H I IPT H CHO H H H H CHO H H H NPT H SO ₃ H H H H H SO ₃ H H H H NPT H SO ₃ H H H H H SO ₃ H H H H SO ₃ H H H H H SO ₃ H H H H BU H CH ₂ HOH H Me H CH ₂ NH ₂ M Me H H H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ NHM Me IPT H Me CH ₂ NHM H Me H CH ₂ NHM Me NPT H Me CH ₂ NHM H Me H CH ₂ NHM Me NPT H Me COME H Me H COOH Et Ph H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et CONHM Et Et Et CONHM ET H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NHMS IPT H NPT IPT NHMS NPT IPT NPT NPT NPT NPT NPT NPT NPT NPT NPT N	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14
H H H iPr H CHO H H H CHO H H H H CHO H H H H Pr H SO H H H H H SO H H CHO H H H H SO H H CHO H H H H CHO H H H H CHO H H H H	Н	Н	Et	н	NO ₂	н			
H H H nPr H SO ₃ H H H H H CI H Me H CH ₂ NH ₂ H Me H CH ₂ NH ₃ H H Me H CH ₂ NH ₃ H Me ET H H Me CH ₂ NH ₃ H H Me H CH ₂ NHM Me nPr H Me COMe H Me H CH ₂ Ph Me nBu H Me COMH H Me H COMH H Me H COMH ET		Н	iPr	н	CHO	н			
H H H BU H CI H H H CI H H H BU H Br H H H Br Me H H H Me CH20H H Me H CH2NH2 Me Et Ph Me CH2NH2 H Me H CH2NHM Me iPr H Me CH2NHM H Me H CH2NHM Me nPr H Me COMe H Me H CH2NHM Me nBU H Me COMH H Me H COME Me tBU H Me COMH H ME H COMH Et Ph H Et CONHM Et Et Et CONHM Et H IPr Et CONHM Et Et Et IPr CONHM ET H NPr IPr NHCMB NPr IPr NPr NHMS NPr H NBU NO2 tBU NBU NO2 LIBU H BU NBU NO2 tBU NBU NO4 LIBU H Ph BU CHO Ph BE H H CH2OH CI NPr CH2OH SO2NHMB NPr CH2OH NPr H CH2OH CI NPr CH2OM COME CI CH2OMB CI CI CH2OMB Et CI CH2OMB COMB CI CH2OMB CI CI CH2OMB NPR CI CH2OMB COMB CI CH2OMB CI CI CH2OMB NPR CI CH2OMB COMB CI CI CH2OMB CI CI CH2OMB NPR CI CH2OMB COMB CI CI CH2OMB CI CI CH2OMB NPR CI CH2OMB COMB CI CI CH2OMB CI CI CH2NH2 Ph CI CH2NH2 CONHMB ET CH2NH2 ET H CH3NH2 PH CH2NH2 CONHMB ET CH2NH2 ET H CH3NHMB MB MB CH2NHMB NPR CH2NHMB MB H CH2NHMB MB CH2NHMB NO2 MB CH3NHMB MB CH2NHMB MB H CH2NHMB NO2 MB CH3NHMB MB H CH2NHMB ND3		H	nPr	н	SO₃H	н			
Me H H Me CH₂OH H Me H CH₂OH Me Et Ph Me CH₂OH H Me H CH₂OH Me Et Ph Me CH₂NHME H Me H CH₂NHME Me nPr H Me CH₂Ph H Me H CH₂Ph Me nBu H Me CH₂Ph H Me H CH₂Ph Me nBu H Me CH₂Ph H Me H CH₂Ph Me nBu H Me CH₂Ph H Me H CH₂Ph Me nBu H Me COOH H Me H CH₂Ph Et H Bu COOH H Me H COOH Et Ph H Et CONHMS Et Et Et COOH Me NO		Н	nBu	н	a	н			
Me Et Ph Me CH2NH2 H Me H CH2NH4 Me iPr H Me CH2NH4 H Me H CH2NHME Me iPr H Me CH2NHME H Me H CH2NHME Me nPr H Me CH2NHME H Me H CH2NHME Me tBu H Me COMH H Me H COMH Me tBu H Me COMH H Me H COMH Me tBu H Me COMH H Me H COMH Et H Et Et CONHMS iPr Et H CONHMS Et H iPr Bt CONHMS iPr Pr nPr NIMM nPr H nPr H Bt NPr Pr NPr NIMM <t< td=""><td>н</td><td>Н</td><td>tBu</td><td>Н</td><td>Br</td><td>Н</td><td></td><td></td><td></td></t<>	н	Н	tBu	Н	Br	Н			
Me IPr H Me CH ₂ NHMe H Me H CH ₂ NHMe Me nPr H Me CH ₂ Ph H Me H CH ₂ Ph H Me H CH ₂ Ph H Me H CCOMe H Me H COOH H Me H CCOH H Me H COOH H LE Et H COOH H LE COOH Me LE LE H COOH Me LE LE H COOH Milms nPr IBU Milms NIMS NIMS NIMS<	Me	Н	н	Me	CH ₂ OH				
Me nPr H Me CH₂Ph H Me H CH₂Ph Me nBu H Me COMe H Me H COMe Me nBu H Me COMe H Me H COMe Et Ph H Et CONHMS H Et H Et H CONHMS H Et H CONHMS IPr CONHMS IPr Et IPr CONHMS IPr IPr CONHMS IPr IPr CONHMS IPr IPr CONHMS IPr IPr NHMS IPr IPr NHMS IPr OH NHMS IPr OH	Me	Et	Ph	Me					
Me nBu H Me COMe H Me H COMe Me tBu H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et Ph H Et H COOH Et Ph H Et H COOH H Bu H COOH Et Ph H Et Et COOH H Et H COOH COOH H COOH H COOH COOH H COOH COOH COOH Me L COOH COOH COOH COOH Me COOH COOH Me COOH Me COOH Me COOH Me Me Me ND Me Me ND Me Me ND Me Me ND Me ND Me ND ND Me ND ND ND ND ND		iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н			
Me IBU H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et COOH H Et H COOH H Et H COOH M Et Et H COOH M F IF COOH M F IF COOH M BU D COOH M	Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph				
Me tBu H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et H Et H CONHME Et Et H CONHME Et Et H CONHME Et Et Et CONHME IPr CE CONHME IPr CONHME Et Et Pr Pr NHMS NPC IPR CONHME IPR CONHME IPR OND NHMS NPC IPR NHMS NPC NHMS NPC NP NHMS NPC NP	Me	nBu	н	Me	COMe	н			
Et Ph H Et CONH ₂ H Et H CONH ₂ CONH ₂ Et H CONH ₂ CONH ₃ Et Et Et CONHMS Et H iPr Et Et CONHMS iPr Et iPr OONHMS iPr H nPr Et CONHMS iPr iPr NPM NPM<		tBu	н	Me	COOH	н			
Et H iPr Et CONHMS iPr Et IPr CONHMS iPr H nPr NHMS nPr IPr nPr NHMS NMS NMS NMS NMS NMS NMS NMS NMS NMS N		Ph	н	Et	CONH ₂	н			
Fr	Et	н	Et	Et	CONHMe				
IPF		н	iPr	Et	CONHMs	iPr			
NPQ		Н	nPr	íPr	NHMs	nPr			
H	nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu			
THU THE	nBu	Н		nBu	NO ₂				
Fh GI Et Ph SO₃H Et Ph Et H CH₂OH CI nPr CH₂OH nPr CH₂OH nPr CH₂OH nPr CH₂OH nPr CH₂OH nPr H H CH₂OH nPr CH₂OH CH₂OH CH CH₂OH CH CH₂OH CI CH₂OH CH CH₂OH	tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph			
CH2OH CI Ph CH2OH OH Ph CH2OH Ph H CH2OME Et CI CH2OME COME CI CH2OME CI CI CH2OME nPr CI CH2OME COOH CI CH2OME CI CI CH2NH2 Ph CI CH2NH2 CONH2 CI CH2NH2 CI CH3NH2 H Et CH2NH2 CONHME Et CH2NH2 Et H CH3NH2 H nPr CH2NH2 CONHMS nPr CH2NH2 nPr H CH3NH2 H Ph CH2NH2 NHMS Ph CH2NH2 Ph H CH3NH2 H Ph CH2NH2 NHMS Ph CH2NH2 Ph H CH2NHME ME CH2NHME NO2 ME CH2NHM ME H CH2Ph Et Et CH2Ph COME nPr CH2Ph nPr H CH2Ph nPr NPr CH2Ph COME nPr CH2Ph nPr H	Ph	a	Et	Ph	so₃H	Εt			
CH₂OH CI Ph CH₂OH OH Ph CH₂OH Ph H CH₂OMe EI CI CH₂OMe COMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe	CH-OH	Cl	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr			
CH2OMe Et CI CH2OMe COMe CI CH2OMe CO CI CH2OMe CO CI CH2OMe CI CH2O		CI	Ph	CH ₂ OH	OH				
CH2OME		Et	CI		COMe				
CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONH ₂ CI CH ₂ NH ₂ CI CI CH ₂ NH ₂ CI CI CH ₂ NH ₂ NP CH ₂ NH ₂ NP H CH ₂ NH ₂ NP H CH ₂ NH ₂ NP H CH ₂ NH ₂ NP CH ₂ NH ₂ <td></td> <td>nPr</td> <td>CI</td> <td>CH₂OMe</td> <td>COOH</td> <td></td> <td></td> <td></td> <td></td>		nPr	CI	CH₂OMe	COOH				
CH ₂ NH ₂ H Et CH ₂ NH ₂ CONHMe Et CH ₂ NH ₂ H CH ₂ NH ₂ H nPr CH ₂ NH ₂ CONHMs nPr CH ₂ NH ₂ nPr H CH ₂ NH ₂ H Ph CH ₂ NH ₂ Ph H CH ₂ NH ₂ Ph H CH ₂ NH ₂ H Ph CH ₂ NH ₂ NO ₂ Me CH ₂ NH ₂ Me Me H CH ₂ Ph Et Et CH ₂ Ph OH Et CH ₂ Ph Et H CH ₂ Ph nPr nPr COMe nPr CH ₂ Ph nPr H		Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI			
CH2NH2 H nPr CH2NH2 CONHMS nPr CH2NH2 nPr CH2NH4 nPr CH2NH4 nPr H CH2NH2 H Ph CH2NH4 NPr NPr Ph H CH2NHM8 Me CH2NHM6 NO2 Me CH2NHM6 Me H CH2Ph Et Et CH2Ph OH Et CH2Ph Et H CH2Ph nPr nPr CH2Ph nPr CH2Ph nPr H		Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe				
CH ₂ NH ₂ H Ph CH ₂ NHM ₂ NHMs Ph CH ₂ NHM ₂ Ph H CH ₂ NHMe Me CH ₂ NHMe NO ₂ Me CH ₂ NHMe Me H CH ₂ Ph CH Et Et CH ₂ Ph OH Et CH ₂ Ph Et H CH ₂ Ph nPr nPr CH ₂ Ph COMe nPr CH ₂ Ph nPr H		H	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs				
CH ₂ NHMe Me Me CH ₂ NHMe NO ₂ Me CH ₂ NHMe Me H CH ₂ Ph Et Et CH ₂ Ph OH Et CH ₂ Ph Et H CH ₂ Ph nPr nPr CH ₂ Ph COMe nPr CH ₂ Ph nPr H		Н	Ph						
CH ₂ Ph Et Et CH ₂ Ph OH Et CH ₂ Ph Et H CH ₂ Ph nPr nPr CH ₂ Ph COMe nPr CH ₂ Ph nPr H		Мe	Me	CH ₂ NHMe					
CH2Ph nPr nPr CH2Ph COMe nPr CH2Ph nPr H		Et	Εt		OH				
		nPr	nPr	CH ₂ Ph					
	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

[0363]

【表195】

				IVIG				
R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14
н	н	Et	Н	NO ₂	н	Н	н	NO ₂
н	Н	ıPr	Н	CHÔ	н	н	Н	CHO
н	Н	nPr	н	so₃H	Н	н	н	so₃H
н	Н	nBu	н	a	Н	Н	н	CI
Ĥ	н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	H	Me	CH ₂ OH	Н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	ıPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	Н	ıPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	n₽r	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	Cl	Et	₽h	so₃H	Et	₽ħ	Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	H
CH ₂ OMe	Εt	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	Cl	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe		Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt	CH ₂ Ph	Et	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	1 COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

【0364】 【表196】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
н	н	Et	н	NO ₂	н	н	Н	NO ₂
H	Н	iPr	Н	CHŌ	н	н	Н	CHO
H	H	nPr	H	SO₃H	н	н	Н	SO₃H
H	Н	nBu	Н	cĭ	н	н	н	Cl
H	н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH ₂ OH	н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	íPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	Н	Et	н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ìPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Εt	Ph	SO ₃ H	Et	Ph	Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	H
СНоМе	Et	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	Cl	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH ₂ NH ₂	Et	н
	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ρħ	н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt	CH ₂ Ph	Εt	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nΡr	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	n COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	н

[0365]

【表197】

HN-R		
HN-Me	HN	HN HN
HN-Et	HN	HN HN
HN	\bigcirc	ОН
ни∼∨	HN	HN HN
ни	HN	HN HN F
HN	ни	HN HN
HN		· ·
HN	ни	HN N N N
HN	HN	HN~S
HN	HN	HN ~ 0 .
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	ни	HN TO HN TO
AN I		

【0366】 【表198】

HN-R			
HN ~ F	HN NH2	HN	Me CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN F	CO₂H HN	NHCH ₂ F	h Me N-Me
HN F	HN CO⁵V	te HN NH	HN OM6
HN NH2	H ₂ NOC	Me O ₂ SHN	HN H ₂ N
HO OH	HN NO ₂	NHSO₂I	Et Ph
HN	HN	ONH ₂ CI	HN 2 Me
HN OH	HN MeO	HN	HN
HNOH	OCF ₃	HN	HN

[0367]

	Me	
HN-R		
HN SO₃H	HN OEt	HN
H ₂ NO ₂ S	Me OCO	OMe
CH₂OH HN	NHCOOE	HN OMe
COCH ³	HN	HN
ÇI	HN OCOCH₃	HN NO ₂
HN CI	HN OH	HN
HN CO	HN OH Me	HN Br
HN	HN OH Br	HN H

【0368】 【表200】

HN-R		
HN	HN	HN
HN-N	HN	HN
HN	HN N	HN NH ₂
HN	HN NH ₂	HN
HN OH	HN NH O2	HNOMe
HN Ņ	OH OH	HNOH
HN	HN H	HNON
HN N	HN H	HN O
HN HN	HN	HN NH ₂
HN	HN~~N	HN CI

【表201】

	Me		
HN-R			
HN	и п	ни	HN N
HN N-N	HN	HN~N	HN N
HN N	HN N	HN~	HN N
HN N	HN N N	HN ~ S	ни
HN N CI	HN N CI	HN NH	HN
HN	N N		HN~N
EN.	HN N) HN	HN N
HN~N~	HN N	N-S	
HN	HN, A	υ	O H
HN \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	HN S	- HN TN	HN TH C

【0370】 【表202】

HN−R			
HN	HN OH	HN C	HN
HN ~		HN	HN N N
HN	HN	HN~~	
HN	HN	HN^	-F HN
HN	HN N	√√ _F	HN N
	HN	HN F	HN O
HN ~	HN F	HN COOH	HN O
HN		F	
HN	HN OH	HN NH ₂	HN ~
HN	HN	HN HN Me	HN N=
HN	HN	HN	HN N CI
HN~~	HN		HN N
ни Он	HN	HN OH	Ŭ
		Un	

[0371]

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~	HN
HN	HN-\O	HN	HN N N
HN	F	HN~~	, N
HN	HN	HN	F HN
HN	HN	F 12	HN ~~~
HN	ни	HN	HN O
HN ~ E	HN	HN COOH	HN
HN~	HN	F HN	HN
HN~	óH HN	HN NH2	HN
HN		HN Me	HN N N CI
1	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN	8
	···· N	OH OH	

【0372】 【表204】

HN-R		
HN-Me	ни	HN HN
HN-Et .	HN .	HN HN
HN ~~	\bigcirc	ОН
ни∼∨	HN	HN HN
ни	HN	HN HN F
ни	HN	HN HN
HN \	HN	Me (
HN~	\wedge	HN N
HN~	HN	HN~S
HN~~	HN	HN O
HN	HN	HN HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	\bigcap	HN CO HN CTO
HN T	ни	

	H	1110	
HN-R			
HN F	HN NH2	HN	HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN	CO₂H HN	NHCH₂Pi	h Ma N Ma
HN F	HN CO ₂ Mi	HN NH	AC ON
HN NH ₂	H ₂ NOC HN	Me O ₂ SHN	HN H ₂ N
HN OH	HN NO ₂	NHSO ₂ E	HN Ph
HN ~	HN	ONH ₂ CN	HN
HN OH	HN HN	HN	HN
HN OH	OCF ₃	HN	HN

【0374】 【表206】

HN-R		
HN SO ₃ H	HN OEt	HN Me
H ₂ NO ₂ S	MeOCO HN	OMe
CH₂OH	NHCOOE!	HN OMe
сосн₃	HN	HN
HN CI	HN OCOCH3	HN CO ₂ H
HN CI	Me OH	HN COMe
HN	OH Me	NHCOPH
HN	OH Br	HN Br
HN	HN	HN H

HN-R		
HN Me	HN	HN
HN .N	HN	HN
HN	HN~~~N	HN NH ₂
HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HN OMe
HN	OH OH	HN
HN N	HN H	HNON
HN N	HN N	HN ~ O
HN N	HN	HN NH ₂
HN O	HN	HN CI

【0376】 【表208】

	н	we	
HN-R			
HN S	ни	HN N	HN N
HN N-N	HN N	NO NH	HN N
N= N=	HN N	HN	HN N
HN	HN N	HN	L)
HN N CI	HN CI	HN NH	ни
T-N'		IN OF	HN N
HN~NA	HN N	- FN	HN
HN N	HN	HN	
HN~~~	HN NH		HN N
HN	HN S	- HN SH	HN TH
	0.7.7		

[0377]

HN−R		
HN-Me	HN	HN HN
HN-Et	HN N	HN HN
ни	\bigcirc	óн
ни✓	ни	HN HN
HN ~	ни	HN TO HN OF
HN	ни	HN HN
HN ~	HN CO	1 ~ F
ни	- NN -	HN HN N
HN	HN	HN~S HN
HN	HN	HN 0.
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	HN	HN TO HN TO
,		

【0378】 【表210】

HN-R			
HN ~ F	HN NH ₂	HN	HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN CI
HN	CO₂H HN	NHCH₂F	HN Me N-Me
HN F	HN CO₂M	e HN NH	HN OM
HN NH ₂	H₂NOC HN	Me O ₂ SHN	H ₂ N
HN OH	HN NO ₂	HN NHSO ₂	Et Ph
HN	HN NHCC	DNH ₂	N HN O Me
HN OH	HN MeO	HN	HN
HN OH	OCF ₃	HN CI	HN

【表211】

HN-R		
HN SO ₃ H	HNODE	HN Me
H ₂ NO ₂ S	HN MeOCO	OMe
CH ₂ OH	NHCOOE:	HNOMe
сосн₃	HN	HN
HN CI	HN OCOCH3	HN CO ₂ H
HN CI	Me OH	HN COMe
HN \	OH Me	HN Br
HN O	OH Br	
HN	HN	HN

【0380】 【表212】

HN-R		
HN Me	HN	HN
HN N	HN	HN
ни	HN NA	HN NH ₂
ни	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HNOMe
HN N	O ₂ OH	ни
HN N	HN H	HN
HN N	HN\\N\\	HN O
HN N	HN	HN~~
HN ~ O	HN	HN CI
		CI_

【表213】

		11/0	
HN−R			
HN S	и	HN N	HN N
HN N-N	HN N	HN~N	HN
HN N	HN	HN ~ C	HN
HN N	HN N	HN	HN-R
HN N CI		HN NH	HN
N N	HN N F	IN NOTE OF THE PARTY OF THE PAR	ни
HN N	~~°) HN	HN
HN N	HN~~~	N-8,	HN
HN	HN N	⊢ HN \\ H \\	HN TN
HN S'	HN S		

【0382】 【表214】

HN-R		
HN-Me	HN_A	HN HN
HN-Et	HN 💭	HN HN
HN~	\bigcirc	óн
ни∕√	HN	HN HN
ни	ни	HN HN F
HN	ни	HN HN
HN \	HN	∫ F Me ✓
HN~	····	HN HN N
HN	HN	HN~S.
HN~~	HN	HN~~
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN NH HN S
HN OH	HN	HN CO HN CO

[0383]

【0384】 【表216】

HN-R		
HN SO ₃ H	HN OEt	HN Me
H ₂ NO ₂ S	Me OCO	OMe
CH ₂ OH	NHCOOE:	HNOMe
COCH ³	HN	НИ
ÇI	HN OCOCH3	HN CO ₂ H
HN CI	HN OH	HN COMe
HN CC	HN OH Me	HN Br
HN CO	OH Br	HN
	_	

【表217】

	Me	
HN-R		
Me HN	HN	HN
HN .N.	HN	HN
HN	HNN	HN NH₂
HN O	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN NH O ₂	HNOMe
HN Ņ	OH OH	HN
HN N	HN H	HN N
HN N	HN ~ N	HN O
HN N	HN	HN
HN~~o	HN	NH₂
HN		CI
HN O		CI

【0386】 【表218】

HN-R			
HN S	HN N	HN N	HN N
HN N-N	HN N	HN	HN N
HN N	HN	HN	HN N
HN N	HN N	HN	ни
N-O-C	HN N CI	HN NH	HN
HN N		HN O	HN~N
AN NA	HN	,	HN
HN	HN TO.) HN NI-S	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN C	HN N	HN N-S	HN NN
HN S	HN	HN TH) HN TH
HN	HN	► HN \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\	HN TH

[0387]

【表219】

HN -R		
HN-Me	HN	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
HN	$\hat{}$	ÓН
ни∼∨	HN	HN HN
HN	HN	HN HN F
HN	ни	HN HN
HN /	\Box	F
ни	HN	HN N N
HN	ни	HN~S
HN	HN	HN~~0~
ни	HN	HN O HN
ни	HN	HN HN S
HN OH	HN	HN O HN O
Ö		

【0388】 【表220】

HN-R			
HN F	HN NH2	HN	Me HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN CI
HN	CO ₂ H	NHCH₂P	h Me N Me
HN F	HN CO₂M	e HN NH	AG OM
HN NH2	H ₂ NOC HN	Me O ₂ SHN	HN H ₂ N
HO OH	HN NO2	NHSO ₂ E	HN Ph
HN	HN	DNH ₂ CN	HN ME
ни он	Me O	HN	HN
HNOH	HN OCF3	HN	HN

[0389]

【表221】

HN-R		
HN SO₃H	HN OEt	HN Me
H ₂ NO ₂ S	Me OCO	OMe
CH₂OH	NHCOOE	HN OMe
сосн	HN	HN
HN CI	HN OCOCH₃	HN NO ₂
HN CI	Me OH	HN COMe
HN CO	OH Me	HN Br
HN	OH Br	HN H

【0390】 【表222】

HN-R	•	
HN Me	HN	HN
HN N	HN	HN
HN	HN N	HN NH ₂
HN	HN NH ₂	HNNHMe
HN OH	HN Me-S-NH	HNOMe
HN N	Ö ₂ OH	HN
HN N	HN H	HNNN
HN N	HN N	HN~°C
HN N	HN	HN
HN~~o	ни	HN CI
HN		Ų c₁
	~ - T	

【表223】

HN-R			
HN S	HN N	HN~N	HN N N
HN N-N	HN N	HN	HN N
HN N	HN N	HN ~	HN (N)
HN NS	HN N N	HN \\	HN-K
HN N CI	HN N CI	HN NH	HN
HN N	HN N	9~\\/	ни~_и~
HN N	~~°) HN	HN N
HN CO	HN N	HN N-S	
HN S	HN N	→ HN \\) HN YN
1114			

【0392】 【表224】

HN-R		
HN-Me	ни	HN HN
HN-Et	HN 💭	HN HN
HN~	\cap	óн У
ни✓	HN	HN HN
ни	HN	HN HN F
HN	HN	HN HN
HN \	HN \	F Me
HN ~	\cap	HN N
HN~	HN	HN S HN
HN	HN	HN O
ни	ни	HN O HN
ни	HN	HN HN S
HN OH	HN	HN O HN TO

[0393]

【表225】

_		IVIC	
HN-R			· · · · · · ·
HN C	HN NH ₂	ни	HN CI
HN F	HN	HN	HN
HN	CO₂H HN	NHCH₂P	h Me N Me
HN F	HN CO₂M	e HN NH	Ac OMe
HN NH ₂	H₂NOC)	Me O ₂ SHN	H ₂ N
HO OH	HN NO ₂	NHSO ₂ E	et Ph
HN	HN	DNH ₂ CN	HN O Me
HN OH	Me O	HN	HN
HN OH	OCF ₉	HN	HN

【0394】 【表226】

HN-R		
HN SO ₃ H	HN OEt	HN Me
H ₂ NO ₂ S	MeOCO HN	OMe
CH ₂ OH	NHCOOE:	HN OMe
COCH3	HN OPh	HN
°'''	HN OCOCH3	HN NO ₂
HN CI	HN OH	HN COMe
δ-/	OH Me	HN NHC OPI
HN 0	OH Br	HN H

【表227】

ни-я		
HN Me	HN	HN
HN H	HN	ни
HN	HN NH	HN NH₂
HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN S-NH Me - S-NH O ₂	HNOMe
ни~и	O ₂ OH	HN
HN N	HN H	HN N
HN N	HN~N	HN
HN N	HN	HN NH ₂
ни~~о	ни	HN CI
HN		CI

【0396】 【表228】

HN-R			
HN S	HN N	NN NH	HN N N
N-N	HN N	HN N	HN
HN N	HN N	HN C	HN~\N
HN N	HN~N	HN	
N=\	HN N CI	HN N NH	HN
HN N O-CI		O-C	HN~N
HN N	HN	-IN	HN
HN	HN) HN N	8
HN CO	HN LY	, HN N-S	ни
	HN	→ HN TN TN	HN N
HN		- 🕓	

【表229】

HN-R		
HN-Me	HN	HN HN
HN-Et	HN	HN HN
HN	\sim	OH V
HN ∕ ▽	ни	HN HN
HN~	HN	HN HN F
HN	HN	HN HN
HN ~	\Box	· ·
HN	ни	HN N Me
HN	ни	HN S HN
HN	HN	HN 0.
ни	HN	HN HN
ни	ни	HN NH HN S
HN OH	HN O	HN CO HN CO
ни		

【0398】 【表230】

HN-R			
HN F	HN NH ₂	HN	Me HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN F	CO ₂ H	NHCH ₂ F	h Me N Me
HN F	HN CO₂M	e HN NH	IAc OM
HN NH2	H ₂ NOC HN	MeO₂SHN HN	HN H ₂ N
HO OH	HN NO ₂	NHSO ₂ t	EI Ph
HN	HN	HN CI	HN O Me
HN OH	HN HN	HN	ни
HN OH	OCF ₃	HN	HN

HN-R		
HN SO ₃ H	HN OEt	HN Me
H ₂ NO ₂ S	Me OCO	OMe
CH ₂ OH	NHCOOEI HN	HN OMe
сосн,	HN	HN
HN CI	HN OCOCH3	HN CO ₂ H
HN	HN OH	HN COMe
HN S	OH Me	HN Br
HN	OH Br	HN H

【0400】 【表232】

ни-к		
Me HN	HN	HN
HN,N	HN	HN
HN	HN~~N	HN NH2
HN	HN NH ₂	HN NHMe
HN OH	HN NH O ₂	HNOMe
ни~и	OH OH	ни
HN N	HN OMe	HN
HN N	HN N	HN~°C
HN P	HN	HN NH ₂
HN~0	HN N	HN CI

【表233】

HN-R			
HN~\\\	N N	N N	HN N
HIN N-N	HN N	HN~NO	HN N
CN_NH	HN N	HN~	HN
HN N	HN N	HN \\	HŅ-L
HN N CI	HN CI	HN NH	HN
N N	HN N H	9-W_	HN
HN	HN O] HN	HN N
HN CO	HN TN	, HN N-S	HN N N
HN	HN S	⊢ HN TH	HN TH

【0402】 【表234】

HN-R			
HN	HN OH	HN	HN N
ни	HN O	HN	
HN	F	ни	
HN	HN	HN~	F HN O
HN \	HN NH	1 ₂	HN S
HN	ни	HN F	HN~~O~
HN~~	HN	HN COOH	HN~O
HN	HN	F HN	HN
\bigcap	óh HN	NH ₂	HN
HN		HN _{Me}	HN N CI
HN	HN	HN	N N N
HN OH	HN	HN	8
		он	

[0403]

HN-R			
HN /	ни	ни	HN N
ни	он	HN \	HN N N
ни	HN~~F	HN \	1
HN	HN CI	HN \	F HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN	ни	√√ _F	HN N
\cap	HN	HN F	HN O
HN	HN F	ни	HN~O
HN		соон Г	
HN	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
HN ~~~	HN S	HN	HN N
ÓН НN ~	HN	HN OH	O
Ö		- On	

【0404】 【表236】

HN-R			
HN	HN \	ни	HN
HN~~~	óн	HN ()	
HN	HN F	HN \	i
HN	HN CI	HN \	^E HN ✓ N
HN \	HN	√√ _F	HN ~ N
\cap	HN	2 HN	HN O
HN	F	HN	HN O
HN	HN	соон	
ни	HNOH	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
	HN S	HN	HN N
HN OH	HN	HN	ď
		о́н	

[0405]

HN-R			
ни	HN OH	HN ~	HN
ни	_	ни	
ни	F	ни	
HN \	HN	HN \	: HN ~~~
HN	HN NH ₂	√ _F	HN S
HN	HN \	HN	HN O
HN \	HN HN	HN	HN~O
ни	HNOH	HN~	HN N
HN	HN	HN NH2	HN
HN	°	HN -Me	HN N CI
1	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN	ъ В
		- ОН	

【0406】 【表238】

【交∠30】

HN-R			
HN	1114	ни	HN N
HN	он . Г	HN \	HN N N
HN	HN F	HN~~	""
HN	HN CI		F HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
	HN \	HN F	HN
HN~~	HN	2 HN	HN~~S~
HN ~	F		HN ~ 0 ~
HN	HN	ни соон	HN~~
HN	HN OH	HN ~	HN
	I HN	HN NH2	HN N
HN \		HN. _{Me}	HN N CI
HN	HN	HN	N
HN OH	HN		HN~N
HN	ни	HNOH	

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~~	HN
HN		HN	
HN	HN F	HN ~~	1
HN	HN	HN \	F HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN ~	HN	√_F •	HN N
HN-~	HN	12 HN	HN C
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
ни	HN	HN Me	HN N CI
ни	ни		HN~N
HN	HN	HN OH	·

【0408】 【表240】

HN-R			
HN ~	HN OH	ни	HN N
ни		ни	HN
HN	HN~~	HN~~	
HN	HN	HN \	F HN O
HN \	HN NH2	√√ _F	HN S
	HN NI 2	HN	HN O
HN .	HN F	HN COOH	HN~~O
HN ~	ſ~\ ^F	COOR	
HN VI	ни он	HN NH ₂	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN \	HN N CI
HN ~	HN S		N NH
HN OH	HN	HN	-

HN-R			
HN/	HN OH	ни	HN N
ни		ни	HN N N
HN	HN~~F	HN ~	, ,
HN	HN	HN \	F HN O
HN \	HN NH;	,	HN S
HN	HN	HN	HN O
HN~~	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN	HN
HN \	HN	NH₂ HN	HN
HN		HN -Me	HN N -CI
	HN	HN	N NH
HN OH	HN \	HN	8
		ÓН	

【0410】 【表242】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴		R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н.	Н	Et	н	NO ₂	н		н	н	NO ₂
H	Н	iPr	Н	CHŌ	Н		Н	Н	CHO
H	н	nPr	Н	SO₃H	Н		Н	Н	so₃H
Ĥ	Н	nBu	H	a	Н		Н	Н	CI
н	н	tBu	н	Br	Н		Н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Εt	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	H		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н		Me	н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н		Et	Н	CONH ₂
Et	н	Et	Et	CONHMe	Εt		Εt	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Εt	CONHMs	ïPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nΡr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt		Ph	Εt	Н
CH ₂ OH	CI	n₽r	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe			CH ₂ OH	nPr	Н
CH2OH	Cl	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI		CH₂OMe	CI	Ci
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	Cl		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH_2NH_2	Et	Н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs			CH_2NH_2	nPr	н
CH ₂ NH ₂	H	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	C	H ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt		CH ₂ Ph	Et	н
CH₂Ph	nPr	n₽r	CH ₂ Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	COOH	Ph	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
	(C	4 1	1	_					

【表243】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹		R ¹³	R14
Н	н	Et	Н	NO ₂	н	Н		Н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHO	Н	н		Н	CHO
н	н	nPr	н	SO ₃ H	Н	Н		Н	SO₃H
н	н	nBu	H	ci	Н	н		Н	CI
H	н	tBu	н	Br	Н	Н		Н	Br
Me	н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me		Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me		Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	H	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me		Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н	Me		Н	CH ₂ Ph
	nBu	н	Me	COMe	Н	Me		Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Mi		Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	Н	E		Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	E		Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	E		iPr	CONHMs
iPr	H	nPr	ıPr	NHMs	nPr	iP		nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nF		nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nΕ		tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	₽h	tB		Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt	P		Εt	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂		nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂		Ph	Н
CH ₂ OMe	Εt	Cl	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ 0		CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ 6		CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	Cl	CH ₂		CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt		NH ₂	Εt	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		NH ₂	nPr	H
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe		Me		НМе	Me	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Et		₂ Ph	Et	H
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr		₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH ₂ C	H ₂ Ph	Ph	Н

【0412】 【表244】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	н	Et	Н	NO ₂	н	Н	Н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHO	Н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	Н	SO₃H	Н	н	н	so₃H
H	н	nBu	н	a	Н	Н	н	CI
Н	н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me	H	CH ₂ OH
Me	Εt	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Me	н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	1Pr	Et	CONHMs	iPr	Εt	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	n₽r	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et	Ph	Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH		Н
CH ₂ OH	a	Ph	CH ₂ OH	OH	₽h	CH ₂ OH		Н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH₂OMe	COMe	CI	CH ₂ GM		CI
CH ₂ OMe	nPr	Cl	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OM		Cl
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NF		Cl
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NF		н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH		н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH		н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHI		н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et	CH ₂ Pi		Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Pt		
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂	Ph Ph	Н

[0413]

【表245】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴		R ¹¹	R ¹³	R14
н	н	Et	Н	NO ₂	н		Н	Н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHÔ	н		Н	н	CHO
H	Н	nPr	н	SO₃H	Н		Н	Н	SO₃H
H	н	nBu	Н	cĭ	н		Н	Н	Cl
н	н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Мe	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	н		Ме	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	н	CH ₂ NH ₂
Me	ıPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н		Me	Н	CH₂NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	н		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	н	n₽r	iPr	NHMs	n₽r		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
Ph	Cl	Et	Ph	SO₃H	Εt		Ph	Εt	н
CH ₂ OH	a	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr		CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	Cl	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Ēt	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI		CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	C1	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	Cl		CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt		CH ₂ NH ₂	Ęt	H
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	₽h	H
CH₂ÑHM e	Мe	Me	CH ₂ NHMe		Me	C	H ₂ NHMe	Me	H
CH₂Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	_	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pr	COOH	Ph		H ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

【0414】 【表246】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	-	R ¹¹	R ¹³	R14
Н	Н	Et	н	NO ₂	Н		н	н	NO ₂
H	Н	iPr	н	CHO	н		Н	Н	CHO
H	н	nPr	н	SO₃H	н		Н	Н	SO₃H
H	Н	nBu	н	ď	н		Н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	₽h	Me	CH ₂ NH ₂	Н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н		Me	H	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н		Ме	Н	COOH
Et	Ph	Н	₽t	CONH ₂	Н		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	í₽r	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	H
₽h	CI	Εt	Ph	SO₃H	Εt		Ph	Et	н
CH ₂ OH	Ci	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe			CH ₂ OH	nPr	H H
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	CI
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI		H ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ OMe	nPr	Cl	CH ₂ OMe	COOH	CI		H ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI Et	H
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et		CH ₂ NH ₂		н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs			CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	н
CH ₂ NHMe	Ме	Me	CH₂NHMe		Me		H ₂ NHMe	Me	H
CH₂Ph	et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	_	CH ₂ Ph	nPr Ph	H
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph_	C	H ₂ CH ₂ Ph	rn_	
		0.41	5			_			

【表247】

R ¹¹ R ¹³ R ¹⁴ R ¹ R ¹³ R ¹⁴ R ¹⁴ R ¹ R ¹³ R ¹⁴ R				R					
H H iPr H CHO H H H CHO H H H SO ₃ H H H H SO ₃ H H H NBU H CI H H H CHO Me H Ph Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me iPr H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me iPr H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me iPr H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me iPr H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me iPr H Me COOH H Me H CH ₂ OH Me iBu H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et CONH ₂ H Et H CONH ₂ Et H Et CONHMS iPr Et iPr CONHMS IPr H NPr iPr NHMS nPr iPr nPr NHMS IPr H nBu nPr NHCOM nBu nPr nBu NO ₂ IBu H NP	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R¹3	R14
H H H IPr H CHO H H H CHO H H H NPr H SO ₃ H H H H CI H H H BI H BF H H H CH Me H CH ₂ OH Me IPr H Me CH ₂ OH Me IPr H Me CH ₂ OH Me NPr H Me CH ₂ OH Me NPr H Me CH ₂ OH Me NBU H Me COOH H Me H CH ₂ OH Me IBU H Me COOH H Me H COOH ELL Ph H ELL CONH ELL H IPr ELL CONH ELL H IPR ELL CONH IPR H NBU NO ₂ IBU NBU NBU NBO NBU H NBU NO ₂ IBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBO NBU H NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBO NBU NBO NBU H NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBO NBU H NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBO NBU NBO NBU H NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBO NBU	н	Н	Et	Н —	NO ₂	н			
H H H nPr H SO ₃ H H H H SP H H SP H SP H H SP H SP H SP						н			
H H H 150 H CI H H H CI H H CI H H H CI H H 150 H BY CH20H H BY Me H CH20H H Me H CH20H Me Et Ph Me CH2NH2 H Me H CH2NHM Me IPT H Me CH2NHM H Me H CH2NHM Me NPT H Me CM2NHM H Me H CH2NHM Me NPT H Me COME H ME H COME ME THE PH H ME COME H ME H COME ME TH ME TH CONTE TH ME TH ME TH CONTE TH ME T					so₃H	Н			
H H H 180 H Br H H H Br Me H CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me Et Ph Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me IPr H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me IPr H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me IPr H Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me IBU H Me COME H ME H COME Et Ph H Me COME H ME H COME Et Ph H Et CONHM Et Et Et Et CONHM Et H Et H CONHM ET IPr IPR INHMS IPP ET IPR INHMS IPR IPR IPR IPR INHMS IPP ET IPR INHMS IPR IPR IPR INHMS IPP ET IPR INHMS IPR IPR IPR IPR INHMS IPR IPR IPR IPR IPR INHMS IPR			nBu			н			
Me H Ph Me CH ₂ OH H Me H CH ₂ OH Me ET Ph Me CH ₂ NHMe H Me H CH ₂ NHMe Me nPr H Me CH ₂ NHMe H Me H CH ₂ Ph Me nBu H Me COMe H Me H COH ₂ Ph Me nBu H Me COMe H Me H COH ₂ Ph Me nBu H Me COMe H Me H COH ₂ Ph Me nBu H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et COOH H Me H COOH Et Ph Et COOH Bu nPr Pr NPr NPr <td></td> <td>Н</td> <td>tBu</td> <td>Н</td> <td>Br</td> <td>Н</td> <td></td> <td></td> <td></td>		Н	tBu	Н	Br	Н			
Me Et Ph Me CH₂NH₂ H Me H CH₂NH₃ Me iPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NHMe H Me H CH₂NHMe H Me H CH₂NHMe H Me H COMe Me H COMe Me H COMe D N N		н	Ph	Me	CH ₂ OH	н			
Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NHMe H CH CH₂NHME H CH CH₂NHME H CH CH₂NHME H CH			Ph			н			
Me nPr H Me CH₂Ph H Me H CH₂Ph Me nBu H Me COMe H Me H COMe Me tBu H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et CONHME Et Et H CONHME Et H Ph Et CONHME Et Et Et CONHME Et H nPr Et CONHME Et Et Et CONHME Et H nPr Et CONHME Et Pr CONHME iPr H nPr Et Pr NO2 ND2 ND2 <td></td> <td></td> <td>н</td> <td></td> <td></td> <td>н</td> <td></td> <td></td> <td></td>			н			н			
Me nBu H Me COMe H Me H COMe Me tBu H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et CONHME Et Et Et CONHME Et H Et Et Et Et Et CONHME Et H IPr Et CONHME IPr Et IPr CONHME IPr H nPr IPr Et CONHME IPr Et IPr CONHME IPr H nPr IPr IPr NPh IPr ONHME NPh IPr NPh H BBu NPh H BBu NPh H BBu NPh H H PPh Et H PPh <td></td> <td></td> <td>н</td> <td>Me</td> <td>CH₂Ph</td> <td>н</td> <td></td> <td></td> <td></td>			н	Me	CH₂Ph	н			
Me tBu H Me COOH H Me H COOH Et Ph H Et H CONH ₂ H Et H CONH ₂ Et H Et Et Et Et Et CONHMS Et H iPr Et Et Et iPr CONHMS iPr H iPr iPr iPr OND IBU iPr ONHMS iPr H nPu nPu IPr NHOM NPu IBU nPr nPr NHMS NHOM NHOM <td< td=""><td></td><td></td><td>н</td><td>Me</td><td></td><td>н</td><td></td><td></td><td></td></td<>			н	Me		н			
Et Ph H Et CONH ₂ H Et H CONH ₂ Et H Et Et Et Et Et Et Et CONHM Et H IPr Et CONHM IPr Et IPr CONHM IPr H nPr Et CONHM IPr IPr NPr OONHM NPr IPr NPr NMMS NPr IPr NPr NMMS NHCOM CO <			н	Me	COOH	н			
Et H Et Et CONHMe Et Et Et CONHME Et H iPr Et IPr CONHMS iPr Et IPr CONHMS iPr H nPr iPr iPr NH IPr CONHMS iPr H nPr iPr iPr nPr NH NH nPr H nBu nPr NHCOM nBu nPr nBu NHCOM nBu H tBu nBu NO2 tBu nBu tBu NO2 tBu H Ph tBu NCO tBu nBu NO2 NPh H H Ph H H Ph H H H Ph H Bu NO2 NBu NPh H H Ph H H Ph CH CH Ph H H Ph H H Ph CH CH		₽h	Н	Et	CONH ₂	н			
Et H IPr Et CONHMS IPr Et IPr CONHMS IPr H nPr iPr iPr NH iPr nPr nPr NHMS nPr H nBu nPr NH nPr nPr nBu NHCOM nBu H tBu nBu nBu tBu nBu tBu nBu tBu nPr nBu tBu NO2 tBu nBu tBu nBu tBu NO2 tBu nBu tBu ND2 tBu CD4			Et	Et	CONHMe	Et			
IPr			ıPr	Et	CONHMs	iPr			
NP			nPr	iPr	NHMs	nPr			
NBU			nBu		NHCOMe	nBu			
tBu H Ph tBu CHO Ph tBu Ph H Ph CI Et Ph SO ₃ H Et Ph Et H CH ₂ OH CI Pt CH ₂ OH SO ₂ NHMe nPr CH ₂ OH nPr H CH ₂ OMe CI Ph CH ₂ OH OH Ph CH ₂ OH Ph H H H H H H H H H H H CM CH CH Ph H H H H H CH CH Ph CH <			tBu		NO ₂	tBu			
Ph CI Et Ph SO ₃ H Et Ph Et H CH ₂ OH CI nPr CH ₂ OH SO ₂ NHMe nPr CH ₂ OH nPr H CH ₂ OH CI Ph CH ₂ OH OH Ph CH ₂ OH Ph H CH ₂ OMe Et CI CH ₂ OMe COMe CI CH ₂ OMe CI CI CH ₂ OMe nPr CI CH ₂ OMe COOH CI CH ₂ OMe CI CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ COOH CI CH ₂ OH CI CI CH ₂ NH ₂ Ph CI CH ₂ NH ₂ CONH CI CH ₂ NH ₂ CI CI CH <			Ph	tBu	CHO	Ph			
CH₂OH CI nPr CH₂OH SO₂NHMe nPr CH₂OH nPr H CH₂OH CI Ph CH₂OH OH Ph CH₂OH Ph H CH₂OH CI CH₂OH CON CI CH₂OH CI CI CH₂OH nPr CI CH₂OH CONH CI CH₂NH CI CI CH₂NH2 Ph CI CH₂NH2 CONH CI CH₂NH3 CI CI CH₂NH2 CI CI CH₂NH3 CI CI CI CI CH₂NH3 CI		CI	Et	Ph	so₃H	Εt			
CH₂OH CI Ph CH₂OH OH Ph CH₂OH Ph CH₂OM Ph CH₂OM Ph Ph Ph Ph Ph Ph Ph Ph CI CH₂OMe COOMe CI CH₂OMe CI CI CH₂OMe CI CI CH₂OMe COOH CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CI CI CH₂OMe CH CH CH₂OMe CH CH CH CH CH CH <td></td> <td>CI</td> <td>nPr</td> <td>CH₂OH</td> <td>SO₂NHMe</td> <td>nPr</td> <td>CH₂OH</td> <td></td> <td></td>		CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH		
CH₂OMe Et CI CH₂OMe COMe CI CH₂OMe CI CI CH₂OMe COMe CI CH₂OMe CI		Cl	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph			
CH₂OMe nPr CI CH₂OMe COOH CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI CI CH₂OMe CI CH₂OMe CI		Εt	CI		COMe	CI			
CH₂NH₂ Ph CI CH₂NH₂ CONH₂ CI CH₂NH₂ CI CH₂NH₂ CI CH₂NH₂ CI CH₂NH₂ CONH₂ CI CH₂NH₂ CI CH₂NH₂ CI CH₂NH₂ CONH₂ CH₂NH₂ CH₂NH₂ CH₂NH₂ CH₂NH₂ CH₂NH₂ CH₂NH₂ CH₂NH₂ CH₂NH₂ NH CH₂NH₃ NP CH₂NH₃ NP H H CH₂NH₂ NP CH₂NH₃ NP H CH₂NH₃ NP CH₂NH₃ NP NP CH₂NH₃ NP NP CH₂NH₃ NP NP CH₂NH₃ NP	CH ₂ OMe	nPr	Cl	CH ₂ OMe	COOH	CI			
CH ₂ NH ₂ H Et CH ₂ NH ₂ CONHMe Et CH ₂ NH ₂ F CH ₂ NH ₂ H nPr CH ₂ NH ₂ CONHMs nPr CH ₂ NH ₂ nPr H nPr H nPr CH ₂ NH ₂ nPr H H H H H CH ₂ NH ₂ NHMs Ph CH ₂ NH ₂ Ph H H CH ₂ NH ₂ NH ₂ NP H CH ₂ NH ₂ NH ₂ NP H CH ₂ NH ₂ NH ₂ NP CH ₂ NH ₂ NH ₂ NP H CH ₂ NH ₂ NH ₂ NP NP CH ₂ Ph NP H CH ₂ Ph CN NP CH ₂ Ph NP H CH ₂ Ph CN NP CH ₂ Ph NP H CH ₂ Ph Ph CH ₂ Ph NP H CH ₂ Ph CN NP CH ₂ Ph NP CH ₂ Ph NP H CH ₂ Ph NP CH ₂ Ph NP <td>CH₂NH₂</td> <td>Ph</td> <td>CI</td> <td>CH₂NH₂</td> <td>CONH₂</td> <td>CI</td> <td></td> <td></td> <td></td>	CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI			
CH₂NH₂ H nPr CH₂NH₂ CONHMS nPr CH₂NH₂ nPr H CH₂NH₂ H Ph CH₂NH₂ NHMS Ph CH₂NH₂ Ph H CH₂NHMe Me CH₂NHMe NO₂ Me CH₂NHMe Me H CH₃Ph Et Et CH₂Ph CH Et CH₂Ph Et H CH₂Ph nPr nPr CH₂Ph COMe nPr CH₂Ph nPr H CH₂CH₂Ph Ph Ph CH₂CH₂Ph COOH Ph CH₂CH₂Ph Ph H	CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt			
CH₂NH₂ H Ph CH₂NH₂ NhMs Ph CH₂NHM₂ Ph H CH₂NHMe Me Me CH₂NHMe Me H CH₂NHMe Me H CH₂NHMe Me H CH₂Ph Et H CH₂Ph Et H CH₂Ph Et H CH₂Ph Et H CH₂Ph DR CH₂Ph Ph H CH₂CH₂Ph Ph Ph CH₂CH₂Ph Ph H CH₂CH₂Ph Ph H CH₂CH₂Ph Ph H CH₂CH₂Ph Ph H CH₂CH₂Ph Ph		Н	nPr						
CH2NHMe Me CH2NHMe NO2 Me CH3NHMe Me H CH2Ph Et CH2Ph OH Et CH2Ph Et H CH2Ph nPr nPr CH2Ph COMe nPr CH2Ph nPr H CH2CH2Ph Ph Ph CH2CH2Ph COOH Ph CH2CH2Ph Ph H		н	₽h	CH ₂ NH ₂					
CH ₂ Ph Et Et CH ₂ Ph CH Et CH ₂ Ph Et H CH ₂ Ph nPr nPr CH ₂ Ph COMe nPr CH ₂ Ph nPr H CH ₂ CH ₂ Ph Ph Ph CH ₂ CH ₂ Ph COOH Ph CH ₂ CH ₂ Ph Ph H		Me	Me	CH₂NHMe					
CH ₂ Ph nPr nPr CH ₂ Ph COMe nPr CH ₂ Ph nPr H CH ₂ CH ₂ Ph Ph Ph CH ₂ CH ₂ Ph COOH Ph CH ₂ CH ₂ Ph Ph H		Et	Et		OH				
CH2CH2Ph Ph Ph CH2CH2Ph COOH Ph CH2CH2Ph Ph H		nPr	nPr	CH ₂ Ph					
		Ph	Ph		COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

【0416】 【表248】

R^MO OH Me

			R"			_			
R ¹¹	R ¹³	R ^{1 4}	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	_	R ¹¹	R13	R14
Н	н	Et	н	NO ₂	н		Н	н	NO ₂
H	Н	iPr	н	CHO	H		H	Н	CHO
H	н	nPr	н	SO₃H	н		Н	Н	SO₃H
H	Н	nBu	н	CĪ	H		Н	Н	Cl
н	Н	tBu	Н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	н		Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	₽h	Me	CH ₂ NH ₂	н		Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н		Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н		Me	Н	CH ₂ Ph
Me	n⊟u	Н	Me	COMe	н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		Me	н	COOH
Et	Ρh	н	Et	CONH ₂	Н		Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	ıPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu		nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt		Ph	Et	н
CH ₂ OH	CI	n₽r	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe			CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph		CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI		H ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	Cl	CH ₂ OM e	COOH	CI		H ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH2NH2	CONHMe	Εt		CH ₂ NH ₂	Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs			CH ₂ NH ₂	nPr	H
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		CH ₂ NH ₂	Ph	H
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe		Me		H ₂ NHMe	Me	H
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		CH ₂ Ph	Et	н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH_2Ph	COMe	nPr		CH ₂ Ph	nPr	
CH₂CH₂Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	1 COOH	Ph	C	H ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

[0417]

【表249】

			R						
R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R14	R1	1	R ¹³	R14
Н	Н	Et	Н	NO ₂	—	Н		н	NO ₂
Н	н	iPr	H	CHO	Н	н		Н	CHO
H	Н	nPr	н	so₃H	Н	н		Н	so₃H
н	Н	nBu	Н	ci	Н	Н		н	CI
н	Н	tBu	H	Br	н	Н		Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me		Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	Н	Mi		Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	H	Me	CH ₂ NHMe	Н	M		Н	CH ₂ NHMe
Мe	nPr	Н	Me	CH ₂ Ph	Н	M		Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	M		Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	M		Н	COOH
Et	Ph	H	Et	CONH ₂	Н	E		Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	E		Et	CONHMe
Et	Н	1Pr	Et	CONHMs	iPr	E		ıPr	CONHMs
ı₽r	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iF		nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nF		nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nE		tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tΕ		Ρh	Н
Ph	Cl	Εt	Ph	so₃H	Et	P		Et	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂		nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂		Ph	H
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI		OMe	CI	Cl
CH ₂ OMe	nPr	Cl	CH ₂ OMe	COOH	CI		OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI		NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt		NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr		NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph		NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Ме	Me	CH ₂ NHMe		Me		NHMe	Me	H
CH ₂ Ph	Εt	Et	CH ₂ Ph	OH	Et		₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	n₽r	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr		₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH ₂ C	CH ₂ Ph	Ph	H

【0418】 【表250】

R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
Н	Н	Et	Н	NO ₂	н	Н	н	NO ₂
Ĥ	н	iPr	н	CHO	н	н	н	CHO
H	н	nPr	н	so₃H	Н	н	н	so₃H
H	Н	nBu	н	a	Н	н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	н	H	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	Н	Me	н	CH ₂ OH
Me	Εt	Ph	Me	CH2NH2	Н	Ме	н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	Н	Me	CH ₂ NHMe	H	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH ₂ Ph	н	Me	Н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н	Me	н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н	Me	н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH ₂	Н	€t	н	CONH ₂
Εt	н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO_2
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	Cl	Εt	Ph	SO ₃ H	Et	₽h	Et	Н
CH ₂ OH	Cl	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	H
CH ₂ OH	CI	Ph	CH2OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	Cl	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	CI	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	Cl	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Et	н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH2NH2	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH ₂ Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	ОH	Et	CH₂Ph	Εt	Н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	Н
CH ₂ CH ₂ Ph		Ph	CH₂CH₂Pt	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	H
	10	1 1	91					

【表251】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R14	R ¹¹	R ^{t3}	R14
Н	н	Et	н	NO ₂	Н	Н	н	NO ₂
H	н	iPr	Н	CHŌ	Н	н	н	CHO
H	Н	nPr	Н	SO ₃ H	Н	н	н	SO₃H
н	Н	nBu	н	ci	н	н	H	Cl
н	н	tBu	н	Br	н	н	н	Br
Me	н	Ph	Me	CH ₂ OH	н	Me	Н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	ıPr	н	Me	CH ₂ NHMe	Н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	н	Me	CH ₂ Ph	Н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	H	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Εt	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	H	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	1Pr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et	Ph	Εt	Н
CH ₂ OH	CI	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	n₽r	н
CH ₂ OH	CI	₽h	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	н
CH ₂ OMe	Εt	CI	CH ₂ OM e	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	Ci
CH₂OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	CI	CH ₂ OMe	Cl	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Εt	CH2NH2	Et	Н
CH ₂ NH ₂	Н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	Н
CH ₂ NH ₂	н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH ₂ NHMe	NO_2	Me	CH ₂ NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	ОH	Εt	CH ₂ Ph	Εt	н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ Pt	COOH	Ph	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Н

【0420】 【表252】

R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
н	н	Et	Н	NO ₂	н	н	н	NO ₂
н	н	iPr	н	CHO	н	н	Н	CHO
н	н	nPr	н	SO ₃ H	н	н	Н	SO₃H
н	н	nBu	н	a	Н	н	н	CI
H	Н	tBu	н	Br	Н	н	н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	н	Me	Н	CH ₂ OH
Мe	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н	Me	Н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	н	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	H	Me	cĤ₂Ph	Н	Me	Н	CH₂Ph
Me	n⊞u	н	Me	COMe	н	Me	н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	H	Et	н	CONH ₂
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO_2
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	a	Et	Ph	so₃H	Et	Ph	Et	н
CH ₂ OH	Cl	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	₽ħ	н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe	CI	Cl
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH ₂ OMe	COOH	Cl	CH ₂ OMe	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	CI
CH ₂ NH ₂	Н	Et	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et	CH ₂ NH ₂	Εt	Н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	Н	Ph	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂	Ph	Н
CH ₂ NHMe	Мe	Me	CH2NHME	NO ₂	Me	CH ₂ NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH ₂ Ph	OH	Εt	CH ₂ Ph	Et	Н
CH ₂ Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	1 COOH	Ph_	CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	н
	T 0	1 0	- T					

[0421]

【表253】

R ^{t1}	R ¹³	R14	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴	R ¹¹	R ¹³	R ¹⁴
н	Н	Et	н	NO ₂	н	н	н	NO ₂
H	н	iPr	н	CHŌ	Н	н	н	CHO
Н	Н	nPr	н	so₃H	Н	н	Н	so₃H
Н	Н	nBu	н	CI	н	н	Н	CI
н	Н	tBu	Н	Br	н	н	н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH ₂ OH	н	Me	н	CH ₂ OH
Me	Et	Ph	Me	CH ₂ NH ₂	н	Me	н	CH ₂ NH ₂
Me	iPr	H	Me	CH ₂ NHMe	н	Me	Н	CH ₂ NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	Н	Me	н	CH ₂ Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н	Me	H	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH ₂	н	Et	Н	CONH ₂
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	€t	iPr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO ₂	tBu	nBu	tBu	NO ₂
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	a	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Et	н
CH ₂ OH	Cl	nPr	CH ₂ OH	SO ₂ NHMe	nPr	CH ₂ OH	nPr	Н
CH ₂ OH	CI	Ph	CH ₂ OH	OH	Ph	CH ₂ OH	Ph	Н
CH ₂ OMe	Et	CI	CH ₂ OMe	COMe	CI	CH ₂ OMe		CI
CH ₂ OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	CI	CH ₂ OMe		CI
CH ₂ NH ₂	Ph	CI	CH ₂ NH ₂	CONH ₂	CI	CH ₂ NH ₂	CI	Cl
CH ₂ NH ₂	н	Εt	CH ₂ NH ₂	CONHMe	Et			н
CH ₂ NH ₂	н	nPr	CH ₂ NH ₂	CONHMs	nPr	CH ₂ NH ₂	nPr	н
CH ₂ NH ₂	н	₽h	CH ₂ NH ₂	NHMs	Ph	CH ₂ NH ₂		Н
CH ₂ NHMe	Me	Me	CH ₂ NHMe	NO ₂	Me	CH ₂ NHM		н
CH₂Ph	Et	Εt	CH₂Ph	OH	Εt	CH₂Ph	Et	н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH ₂ Ph	COMe	nPr	CH ₂ Ph	nPr	н
CH ₂ CH ₂ Ph	Ph	Ph	CH ₂ CH ₂ PI	COOH	Ph	CH₂CH₂P	h Ph	н
	T \wedge	1 0	0 1					

【0422】 【表254】

HN-R			
HN	HN \	HN~~	HN N
HN ~~~	óн Г	HN~	
HN	HN~~F		HN
HN	HN	HN	F HN
\sim	HN	HN F	HN N
HN~~	ſ~\ ^{NI}	HN N	HN~~S~
ни	HN F	· }	HN ~~ 0 ~
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	F HN	HN
HN	HN	HN H2	HN
HN		HN Me	HN N -ci
HN OH	HN S	HN	HN~N
HN OH	ни	HN OH	

[0423]

本発明化合物は、3位と4位に不斉炭素を有しており、該不斉炭素に基づく光学異性体 が存在するが、ラセミ体と同様に光学活性体も本発明の用途に用いることができる。又、 3位と4位の立体配置に基づくシス又はトランス異性体も包含するが、好ましくはトランス異性体である。

[0424]

又、塩の形成可能な化合物であるときはその医薬的に許容し得る塩も有効成分として用いることができる。

[0425]

医薬的に許容し得る塩としては塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、メタンスルホン酸塩、 酢酸塩、安息香酸塩、酒石酸塩、リン酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ 酸塩、グルコン酸塩及びサリチル酸塩等が挙げられる。

[0426]

好ましくは、塩酸塩、マレイン酸塩及びメタンスルホン酸塩が挙げられる。

[0427]

次に本発明化合物の製法を説明する。

[0428]

一般式 (I)、 (II) によって表される化合物のうち、 R^4 が水素原子であり、 R^3 が水酸基である (I-a)、 (II-a) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (1) 又は式 (2) により表される化合物と化合物 (3) を不活性溶媒中反応させることにより得ることができる。

[0429]

【化19】

$$(1) \qquad (2) \qquad R^{5} \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$R^{5} \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$R^{5} \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$A \qquad OH \qquad (A) \qquad OH \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$A \qquad OH \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$A \qquad OH \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$A \qquad OH \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$A \qquad OH \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

$$A \qquad OH \qquad (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} V - (CH_{2})_{\overline{n}} R^{6}$$

[0430]

式 (1)、式 (2) によって表される化合物と化合物 (3) の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

[0431]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

[0432]

反応温度は、通常-80℃から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10℃~100℃である。

[0433]

反応原料のモル比は、化合物 (3) /化合物 (1) 又は化合物 (2) は $0.5 \sim 4.0$ の範囲であり、好ましくは $1.0 \sim 2.0$ の範囲である。

[0434]

反応には酸触媒を用いてもよい。

[0435]

用いる酸触媒としては、塩酸、硫酸に代表される無機酸、塩化アルミニウム、四塩化チタン、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体、過塩素酸、過塩素酸リチウム、臭化リチウム、トリフルオロメタンスルホン酸イッテルビウムに代表されるルイス酸等が挙げられる

[0436]

好ましくは、臭化リチウム、過塩素酸リチウムが挙げられる。

[0437]

一般式 (I) 、 (II) により表される化合物のうち光学活性体の合成は、ラセミ体を光学分割する方法 (特開平 3-141286 号公報、米国特許 5097037 号及び欧州特許 409165 号)を利用することにより達成される。

[0438]

又、一般式(1)、(2)により表される化合物の合成は、以下の合成法を利用することにより達成される。

[0439]

○ベンゾピラン環一般合成法

既知の方法(J. M. Evans ら、J. Med. Chem. 1984, 27, 1127、J. Med. Chem. 1986, 29, 2 194、J. T. NorthらJ. Org. Chem. 1995, 60, 3397や、特開昭 5 6 - 5 7 7 8 5 号公報、特開昭 5 6 - 5 7 7 8 6 号公報、特開昭 5 8 - 1 8 8 8 8 0 号公報、特開平 2 - 1 4 1 号公報、特開平 1 0 - 8 7 6 5 0 号広報及び特開平 1 1 - 2 0 9 3 6 6 号広報等に記載の方法)に従って合成することができる。

[0440]

○インドール、オキシインドール

- T. Sakamoto, et al., Heterocycles, 1986, 24, 31.
- M.Belley, et.al., Synthesis, 2001, 222.
- A.D.Cross, et al., J. Chem. Soc., 1961, 2714.

○イミダゾリノン

- J.Kitteringham, et.al., Synthetic Commun., 2000, 30, 1937.
 - ○キノリン
- S. Imor, et al., Synthetic Commun., 1996, 26, 2197.
- Y. Kitahara, et al., Tetrahedron, 1997, 53, 6001.
- A.G. Osborne, et al., J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1993,181.
- R. T. Shuman, et al., J. Org. Chem., 1990, 55,738.
- T. Sakamoto, et al., Chem. Pharm. Bull., 1981, 29,2485.
- Y. Tsuji, et al., J. Org. Chem., 1987, 52, 1673.
- Z. Song, et al., J. Heterocyclic Chem., 1993, 30,17.

○キノリノン

- M.R.Sabol, et al., Synthetic Commun., 2000, 30, 427.
- Z-Y. Yang, et al., Tetrahedron Lett., 1999, 40, 4505.
- H-BSun, et al., Synthesis, 1997, 1249.
- A. Guiotto, et al., J. Heterocyclic Chem. 1989, 26, 917.
- K. Konno, et al., Heterocycles 1986, 24,2169.
- E. Fernandez, et al., Synthesis 1995, 1362.

○ベンゾチアゾール、トリアゾール、

- N.B. Ambati, et al., Synthetic Commun., 1997, 27, 1487.
- D.E.Burton., et al., J. Chem. Soc (C). 1968, 1268.
 - ○キノキサリン、キノキサリノン
- J.H.Liu, et al., J. Org. Chem., 2000, 65, 3395.
- J.J.Li, et al., Tetrahedron Lett., 1999, 40,4507.
- Y. Ahmed, et al., Bull. Chem. Soc. Jpn., 1987, 60, 1145.

○ベンズオキサジノン

G.H.Jones, et al., J. Med. Chem., 1987, 30,295.

J.L. Wright, et al., J. Med. Chem., 2000, 43,3408.

M. Kluge, et al., J. Heterocyclic Chem., 1995, 32,395.

一般式 (1) 又は (2) で表される化合物のうち、Aが式 (5) であり、R 4 が水素原子であり、R 3 が水酸基である (1-a)、(2-a) で表される化合物は、一般式 (6) 又は式 (7) により表される化合物から既知の方法 (J. M. Evansら、J. Med. Chem. 1984, 27, 1127、J. Med. Chem. 1986, 29, 2194、J. T. NorthらJ. Org. Chem. 1995, 60, 33 97や、特開昭 56-57785 号公報、特開昭 56-57785 号公報、特開昭 58-188885 号公報、特開平 2-141 号公報、特開平 10-8765 0号広報及び特開平 11-20936 6号広報等に記載の方法)により得ることができる。

[0441]

【化20】

[0442]

式 (6), (7) であらわされる化合物は化合物 (8) と化合物 (9) を反応させることにより得ることもできる。(参考文献 Y. Tsuji ら, J. Org. Chem., 1987, 52, 1673.)

[0443]

【化21】

[0444]

式(8)によってあらわされる化合物と化合物(9)の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

[0445]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキ シエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル によって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンに よって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

[0446]

反応温度は、通常-80℃から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10℃~200℃である。

[0447]

反応原料のモル比は、化合物 (8) /化合物 (9) は $0.1 \sim 4.0$ の範囲であり、好ましくは $0.5 \sim 2.0$ の範囲である。

[0448]

反応には遷移金属触媒と配位子を用いても良い

用いる遷移触媒としては、塩化ルテニウム、ジクロロトリストリフェニルホスフィンルテニウム、ジブロモトリストリフェニルホスフィンルテニウム、ジヒドリドテトラキストリフェニルホスフィンルテニウム、(η 4-シクロオクタジエン)(η 6-シクロオクタトリエン)ルテニウム、ジクロロトリカルボニルルテニウムダイマー、ドデカカルボニルトリルテニウム、(η 5-ペンタメチルシクロペンタジエニル)クロロ(η 4-シクロオクタトリエン)ルテニウム、酢酸パラジウム、塩化パラジウム、ジクロロビストリフェニルホスフィンパラジウム、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、ビスジベンジリデンアセトンパラジウム、塩化ロジウム、クロロトリストリフェニルホスフィンロジウム、ヒドリドカルボニルトリストリフェニルホスフィンロジウム、ヒドリドトリストリフェニルホスフィンロジウム、ジ- μ -クロロテトラカルボニルニロジウム、クロロカルボニルビストリフェニルホスフィンイリジウム、(η 5-ペタメチルシクロペンタジエニル)ジクロロイリジウムダイマー、ニッケルテトラキストリフェニルホスフィン、ジコバルトオクタカルボニル、(η 5-シクロペンタジエニル)ジカルボニルコバルト等が挙げられ。

[0449]

好ましくは塩化ルテニウムが挙げられる。

[0450]

配位子としてはトリメチルホスフィン、トリエチルホスフィン、トリn-プロピルホスフィン、トリi-プロピルホスフィン、トリn-ブチルフォスフィン、トリt-ブチルフォスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリフェニルホスフィン、トリ(o-トリル)ホスフィンに代表される単座ホスフィン系配位子、1,2-ビスジフェニルホスフィノエタン、1,3-ビスジフェニルホスフィノプロパン、1,4-ビスジフェニルホスフィノブタン、1,2-ジエチルホスフィノエタンに代表される2座ホスフィン系配位子、トリエチルホスファイト、トリブチルホスファイト、トリフェニルホスファイト、トリ(o-トリル)ホスファイトに代表されるホスファイト配位子が挙げられる。

[0451]

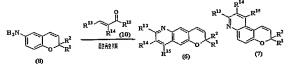
好ましくはトリウェニルホスフィン、トリn-ブチルフォスフィン、トリt-ブチルフォスフィンが挙げられる。

[0452]

式 (6), (7) であらわされる化合物は化合物 (8) と化合物 (10) を酸触媒存在下反応させることによっても得ることができる。(参考文献 Y. Kitaharaら、Tetrahedron Lett.1997, 53, 6001.、Z. Song ら J. Heterocyclic Chem., 1993, 30, 17.)

[0453]

【化22】



[0454]

式(8)によってあらわされる化合物と化合物(10)の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

[0455]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテルによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、酢酸、トリフルオロ酢酸に代表される

有機酸系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましく はエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒、有機酸系溶媒が挙げられる。

[0456]

用いる酸触媒としては、塩酸、硫酸、硝酸、リン酸に代表される無機酸、メタンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸に代表される有機スルホン酸、塩化アルミニウム、四塩化チタン、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体、過塩素酸、塩化亜鉛、臭化亜鉛、ヨウ化亜鉛、塩化鉄(II)、塩化鉄(II)、塩化銅(I)、塩化銅(II)に代表されるルイス酸が挙げられる。好ましくは、塩酸、塩化亜鉛が挙げられる。

[0457]

反応に用いる反応温度は、通常-80 Cから用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10 C ~ 200 C である。

[0458]

反応原料のモル比は、化合物(10)/化合物(8)は $1\sim10$ の範囲であり、好ましくは $1\sim3$ の範囲である。

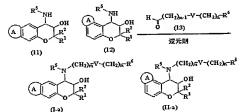
[0459]

又、一般式(1)、(2)により表される化合物の光学活性体の合成は、不斉合成による方法(特表平5-507645号公報、特開平5-301878号公報、特開平7-285983号公報、欧州特許535377号及び米国特許5420314号)を利用することにより達成される。

[0460]

一般式 (I) 又は (II) で表される化合物のうち、 R^4 が水素原子であり、 R^3 が水酸基である (I-a)、 (II-a) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (11) 又は式 (12) により表される化合物と化合物 (13) を不活性溶媒中還元的アミノ化反応させることによっても得ることができる。

【0461】 【化23】



[0462]

式 (11)、式 (12) によって表される化合物と化合物 (13) の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

[0463]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、上記溶媒を任意に混合した条件や無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

[0464]

一般式 (I) 又は (II) で表される化合物のうち、 R^4 が水素原子であり、 R^3 が水酸基であり、mが1であり、VがC R^7 O Hである (I-b) 、 (I I-b) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (1 1) 又は式 (1 2) により表さ

れる化合物と化合物(14)を不活性溶媒中反応させることによっても得ることができる

【0465】 【化24】



[0466]

式 (11)、式 (12) によって表される化合物と化合物 (14) の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

[0467]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

[0468]

反応温度は、通常-80℃から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10℃~100℃である。

[0469]

反応原料のモル比は、化合物(14)/化合物(11)又は化合物(12)は $0.5\sim4.0$ の範囲であり、好ましくは $1.0\sim2.0$ の範囲である。

[0470]

反応には酸触媒を用いてもよい。

[0471]

用いる酸触媒としては、塩酸、硫酸に代表される無機酸、塩化アルミニウム、四塩化チタン、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体、過塩素酸、過塩素酸リチウム、臭化リチウム、トリフルオロメタンスルホン酸イッテルビウムに代表されるルイス酸等が挙げられる

[0472]

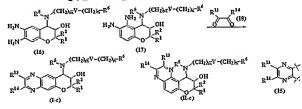
好ましくは、臭化リチウム、過塩素酸リチウムが挙げられる。

[0473]

一般式 (I)、 (II) によって表される化合物のうち、 R^4 が水素原子であり、 R^3 が水酸基、Aが式 (15) の (I-c)、 (II-c) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (16) 又は式 (17) により表される化合物と化合物 (18) を不活性溶媒中、反応させることによっても得ることができる。

[0474]

【化25】



[0475]

式 (16)、式 (17) によって表される化合物と化合物 (18) の反応に用いる溶媒 としては下記のものが挙げられる。

[0476]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、上記溶媒を任意に混合した条件や無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはアルコール系溶媒が挙げられる。

[0477]

反応温度は、通常-80℃から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10℃~50℃である。

[0478]

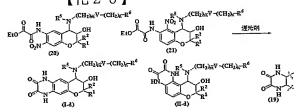
反応原料のモル比は、化合物(18)/化合物(16)又は化合物(17)は $0.5 \sim 4.0$ の範囲であり、好ましくは $0.8 \sim 2.0$ の範囲である。

[0479]

一般式 (I)、(II) によって表される化合物のうち、 R^4 が水素原子であり、 R^3 が水酸基、A が式 (19) の (I-d)、(II-d) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (20) 又は式 (21) により表される化合物を不活性溶媒中、還元反応させることによっても得ることができる。

[0480]

【化26】



[0481]

ー般式 (I)、(II) によって表される化合物のうち、 R^4 が水素原子であり、 R^3 が水酸基、Aが式 (22) (XがS O_2 ZはC Oであり、YがS ZはOである。)であり(I -e)、(I I -e) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (23) Zは式 (24) により表される化合物を不活性溶媒中、塩基性条件で閉環させることによっても得ることができる。

[0482]

[0483]

[0484]

前述したように、本発明者らは一般式(I)、(II)で表わされる化合物には強い不応期延長作用を有していることを見い出した。不応期延長作用は抗不整脈作用の奏功機序の1つであり、臨床の不整脈に対する有効性を外挿しうる重要な指標である。不応期延長作用を主たる機序とする従来の抗不整脈薬(例えばVaughanWilliamsによる抗不整脈薬分類の第3群に属するdーソタロールなど)は、不応期延長作用と関連のある心室筋活動電位の延長に基づくtorsadesde pointes等の突然死を誘発しうる極めて危険な不整脈誘発作用が重大な課題とされており、心房筋が主体の不整脈(上室性頻拍症、心房粗動、心房細動など)に対する治療の問題になっている。

[0485]

この課題を解決するために本発明者らは、心室筋よりも心房筋に選択的な不応期延長作用を有する化合物の探索研究を実施し、一般式(I)又は(II)で表される化合物に、心室筋の不応期および活動電位に影響することなく心房筋に選択的な不応期延長作用があることを見出した。本発明者らの発見の既存技術との違いは、これらの化合物群に対して心房筋に選択的な不応期延長作用を付与し得たところにあり、このことは、摘出した心室筋の活動電位持続時間に影響しないこと、および麻酔動物の心電図QTに影響を及ぼさないことによっても示されている。以上のことから、本化合物は心室筋における不整脈誘発作用を持ち合わせず、既存技術に比べて心房筋が主体の不整脈においてより安全な使用に貢献できる可能性を提供しうるものである。この技術は、心房性不整脈に係わる、例えば発作性、慢性、手術前、手術中あるいは手術後の抗心房細動剤、抗心房粗動剤、抗心房性類脈剤としての治療あるいは手術後の抗心房細動剤、抗心房粗動剤、抗心房性類脈剤としての治療あるいは手術後の抗心房とする心室性不整脈の多いは頻脈への移行の予防、心室性不整脈あるいは頻脈である。

[0486]

本発明は、これらの治療に一般式(I)、(II)で表わされる化合物の有効な量を含む医薬組成物又は獣医薬組成物を提供する。

[0487]

本発明に係る化合物の投与形態としては、注射剤(皮下、静脈内、筋肉内、腹腔内注射)、軟膏剤、坐剤、エアゾール剤等による非経口投与又は錠剤、カプセル剤、顆粒剤、丸剤、シロップ剤、液剤、乳剤、懸濁液剤等による経口投与をあげることができる。

[0488]

本発明に係る化合物を含有する上記の医薬的又は獣医薬的組成物は、全組成物の重量に対して、本発明に係る化合物を約0.01~99.5%、好ましくは、約0.1~30%を含有する。

[0489]

本発明に係る化合物に又は該化合物を含有する組成物に加えて、他の医薬的に又は獣医薬的に活性な化合物を含ませることができる。

[0490]

また、これらの組成物は、本発明に係る化合物の複数を含ませることができる。

[0491]

本発明化合物の臨床的投与量は、年令、体重、患者の感受性、症状の程度等により異なるが、通常効果的な投与量は、成人一日0.003~1.5g、好ましくは、0.01~0.6g程度である。しかし必要により上記の範囲外の量を用いることもできる。

[0492]

本発明化合物は、製薬の慣用手段によって投与用に製剤化される。

[0493]

即ち、経口投与用の錠剤、カプセル剤、顆粒剤、丸剤は、賦形剤、例えば白糖、乳糖、ブドウ糖、でんぷん、マンニット;結合剤、例えばヒドロキシプロピルセルロース、シロップ、アラビアゴム、ゼラチン、ソルビット、トラガント、メチルセルロース、ポリビニルピロリドン;崩壊剤、例えばでんぷん、カルボキシメチルセルロース又はそのカルシウム塩、微結晶セルロース、ポリエチレングリコール;滑沢剤、例えばタルク、ステアリン酸マグネシウム又はカルシウム、シリカ;潤滑剤、例えばラウリル酸ナトリウム、グリセロール等を使用して調製される。

[0494]

注射剤、液剤、乳剤、懸濁剤、シロップ剤及びエアゾール剤は、活性成分の溶剤、例えば水、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、プロピレングリコール、1,3ーブチレングリコール、ポリエチレングリコール;界面活性剤、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、水素添加ヒマシ油のポリオキシエチレンエーテル、レシチン;懸濁剤、例えばカルボキシメチルナトリウム塩、メチルセルロース等のセルロース誘導体、トラガント、アラビアゴム等の天然ゴム類;保存剤、例えばパラオキシ安息香酸のエステル、塩化ベンザルコニウム、ソルビン酸塩等を使用して調製される。

[0495]

経皮吸収型製剤である軟膏には、例えば白色ワセリン、流動パラフィン、高級アルコール、マクロゴール軟膏、親水軟膏、水性ゲル基剤等が用いられる。

[0496]

坐剤は、例えばカカオ脂、ポリエチレングリコール、ラノリン、脂肪酸トリグリセライド、ココナット油、ポリソルベート等を使用して調製される。

【実施例】

[0497]

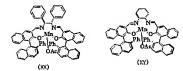
以下、本発明を実施例にて詳述するが、本発明は、これらの実施例に何ら限定されるものではない。

[0498]

尚、Ph, Phサレンマンガン錯体(XX)、Cyc, Phサレンマンガン錯体(XY)とは以下の構造式で示される光学活性化合物を意味し、特開平 7-285983 号公報記載の方法に順次じて合成したものを用いた。

[0499]

【化28】



[0500]

合成例1

2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩

[0501]

【化29】

[0502]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0503]

【化30】



[0504]

6-アミノ-2,2-ジメチルクロメン (10.1g,57.7mmol)のエタノール溶液(500mL)に室温でメチルビニルケトン(33.0mL,404mmol)、m-ニトロベンゼンスルホン酸(21.1g,104mmol)、塩化亜鉛(1.97g,14.4mmol)、35%塩酸(24mL,289mmol)を加え、110で5時間攪拌した。反応終了後、エタノールを留去し、水を加え、炭酸水素ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出し、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、中圧カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、目的物(収率38%)を得た。

褐色無定形

 1 H-NMR(CDC1₃) δ ; 1.51(s, 6H), 2.59(d, J =0.6 Hz, 3H), 5.90(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6, 59(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.11(d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.25(s, 1H), 7.68(s, 1H), 8.57(d, J = 4.4 Hz, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 226[M+1]^{+}$

[0505]

2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール

[0506]

【化31】



[0507]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(530mg, 2.35mmol)のジメチルスルホキシド溶液(8mL)に室温でN-プロモサクシンイミド(920mg,5.17mmol)、水(1.6mL)を加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水層に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、さらに酢酸エチルで抽出し、有機層を合わせて無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を留去し、3-プロモ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-4-オールの粗物を得た。室温で1,4-ジオキサン(30mL)、1mol/L水酸化ナトリウム水溶液(5.64mL)を加え、室温で2.5時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去することで、3,4-エポキシ-2,2,5-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリンの粗物を得た。室温で残渣に1,4-ジオキサン(3.2mL)、過塩素酸リチウム(250mg,2,35mmol)、2-フェニルエチルアミン(0.35mL,2.82mmol)を加え、75℃で5時間攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液に炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物(3段階 収率26%)を得た。

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \quad \delta \; ; \; 1.26 \, (\text{s}, \; 3\text{H}) \; , \; 1.55 \, (\text{s}, \; 3\text{H}) \; , \; 2.59 \, (\text{s}, \; 3\text{H}) \; , \; 2.83 \, (\text{t}, \; \text{J} = 6.8 \; \text{Hz}, \; 2\text{H}) \; , \\ 2.96 - 3.12 \, (\text{m}, \; 3\text{H}) \; , \; 3.60 \, (\text{d}, \; \text{J} = 10.5 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}) \; , \; 3.88 \, (\text{dd}, \; \text{J} = 1.1 \; \text{Hz}, \; 10.5 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}) \; , \; 7.18 - 7.32 \, (\text{m}, \; 6\text{H}) \; , \; 7.98 \, (\text{d}, \; \text{J} = 1.1 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}) \; , \; 8.60 \, (\text{d}, \; \text{J} = 4.4 \; \text{Hz}) \; , \; 1.4 \, (\text{d}, \; \text{J} = 1.1 \; \text{Hz}, \; \text{JH}) \; , \; 1.4 \, (\text{d}, \; \text{J} = 1.4 \; \text{Hz}) \; , \; 1.4 \, (\text{d}, \; \text{J} = 1.4 \; \text{J}) \; , \; 1.4 \, (\text{d}, \; \text{J$

Hz, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 363[M+1]^{+}$

[0508]

2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール(219mg, 0.60mmol)の酢酸エチル溶液(3mL)にマレイン酸(77mg, 0.66mmol)の酢酸エチル(1 mL)溶液を滴下し、反応液を0℃に冷却しヘキサン(10mL)を加え、析出した固体を濾過することにより2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩(収率72%)を得た。

黄色結晶

mp.;172-174℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6}) \ \delta \ ; \ 1.17(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 1.50(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 2.59(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 2.94-3.37(\text{m}, \ 4\text{H}), \ 4.10(\text{dd}, \ J=6.1 \ \text{Hz}, \ 9.4 \ \text{Hz}, \ 1\text{H}), \ 4.72(\text{d}, \ J=9.4 \ \text{Hz}, \ 1\text{H}), \ 6.09(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 6.33(\text{d}, \ J=6.1 \ \text{Hz}, \ 1\text{H}), \ 7.23-7.35(\text{m}, \ 6\text{H}), \ 7.42(\text{s}, \ 1\text{H}), \ 8.43(\text{s}, \ 1\text{H}), \ 8.66(\text{d}, \ J=4.1 \ \text{Hz}, \ 1\text{H})$

[0509]

合成例 2

2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール

[0510]

【化32】



[0511]

合成例1の方法に準拠して合成した。

[0512]

2.2.7.9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0513]

【化33】



[0514]

(収率59%)

黒褐色油状物

 1 H-NMR(CDCl₃) δ ; 1.49(s, 6H), 2.54(s, 3H), 2.62(s, 3H), 5.86(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6,55(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.00(s, 1H), 7.20(s, 1H), 7.60(s, 1H) MS(ESI⁺)m/z;240[M+1]⁺

[0515]

3-ブロモ-2, 2, 7, 9-テトラメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-4-オール

[0516]

【化34】

[0517]

(収率82%)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.47(s, 3H), 1.68(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.70(s, 3H), 4.28(d, J = 9.6 Hz, 1H), 5.14(d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 7.28(s, 1H), 8.37(s, 1H) MS(ESI⁺)m/z; 336,338 [M+1]⁺

[0518]

2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]

出証特2005-3008820

```
キノリン-3-オール(収率17%)
白色結晶
mp.;144-147℃
^{1}H-NMR(CDC1<sub>3</sub>) \delta; 1.25(s, 3H), 1.54(s, 3H), 1.90(br s, 1H), 2.55(s, 3H), 2.65(s,
3H), 2.81(t, J = 6.8 \text{ Hz}, 2H), 2.97-3.10(m, 2H), 3.19(br s, 1H), 3.58(d, J = 10.5)
Hz, 1H), 3.85(d, J=10.5 Hz, 1H), 7.04(s, 1H), 7.17-7.31(m, 6H), 7.91(s, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 377[M+1]<sup>+</sup>
MS(ESI-)m/z; 421 [M+45]^+
   [0519]
合成例3
2,2,8,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2.3-g]
キノリン-3-オール 1マレイン酸塩
   [0520]
     【化35】
   [0521]
  合成例1の方法に準拠して合成した。
   [0522]
2,2,8,9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン
   [0523]
     【化36】
   [0524]
(収率50%)
^{1}H-NMR(CDC1<sub>3</sub>) \delta; 1.50(s, 6H), 2.50(s, 3H), 2.66(s, 3H), 5.87(d, J = 9.9 Hz, 1H),
 6,57(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.26(s, 1H), 7.63(s, 1H), 8.48(s, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 240[M+1] +
   [0525]
3-ブロモ-2, 2, 7, 9-テトラメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-4-オール
   [0526]
     【化37】
   [0527]
(収率65%)
^{1}H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) \delta; 1.48(s, 3H), 1.69(s, 3H), 1.80(br s, 1H), 2.46(s, 3H), 2.56(s,
3H), 4.28(d, J = 9.6 \text{ Hz}, 1\text{H}), 5.15(d, J = 9.6 \text{ Hz}, 1\text{H}), 7.25(s, 1\text{H}), 8.42(s, 1\text{H}),
8.57(s. 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 336,338 [M+1] +
   [0528]
2,2,8,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]
キノリン-3-オール 1マレイン酸塩
(収率4%)
白色結晶
mp.;199-203℃
^{1}H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) \delta; 1.17(s, 3H), 1.50(s, 3H), 2.41(s, 3H), 2.49(s, 3H), 2.89-3.40
```

(m, 4H), 4.07(dd, J = 5.5 Hz, 9.4 Hz, 1H), 4.66(d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.28(d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.22-7.35(m, 5H), 7.43(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.59(s, 1H)

MS(ESI⁺)m/z; 377[M+1] ⁺ MS(ESI-)m/z; 421 [M+45] ⁺

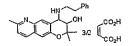
[0529]

合成例4

2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩

[0530]

【化38】



[0531]

2,2,7-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0532]

【化39】



[0533]

6-アミノ-2,2-ジメチルクロメン(1.00g,5.71mmol)に室温で35%塩酸(1.43mL,17.1mmol), p-クロラニル(1.40g,5.71mmol)、n-ブタノール(1.3mL)を加え、120 に昇温した。クロチルアルデヒド(0.567mL,6.84mmol)のn-ブタノール溶液(0.52mL)を添加し、120 で20分攪拌した。塩化亜鉛(0.777g,5.71mmol)のテトラヒドロフラン溶液(10mL)を添加し、120 でで20分攪拌した。反応終了後、炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、酢酸エチルから再結晶することにより、目的物(収率22%)を得た。

灰色固体

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.48(s, 6H), 2.67(s, 3H), 5.87(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6,55(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.05(s, 1H), 7.16(d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.64(s, 1H), 7.86(d, J = 8.5 Hz, 1H)

MS(ESI⁺)m/z; 226[M+1] ⁺

MS(ESI-)m/z; 225 [M] +

[0534]

3-ブロモ-2, 2, 7-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-4-オール

【0535】 【化40】



[0536]

合成例1の方法に準拠して合成した。

(収率24%)

[0537]

2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩

(収率12%)

白色結晶

 ${}^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6}) \ \delta \ ; \ 1.15(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 1.48(\text{s}, \ 3\text{H}), 2.63(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 2.70-3.38(\text{m}, \ 4\text{H}), \ 4.09 \ (\text{dd}, \ J = 5.8 \ \text{Hz}, \ 9.4 \ \text{Hz}, \ 1\text{H}), \ 4.68(\text{d}, \ J = 9.4 \ \text{Hz}, \ 1\text{H}), \ 6.08(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 6.29(\text{d}, \ J = 5.8 \ \text{Hz}) \ \text{deg} \ (\text{deg}, \ J = 5.8 \ \text{Hz}) \ \text{deg} \ (\text{deg}, \ J = 5.8 \ \text{Hz}) \ \text{deg} \ (\text{deg}, \ J = 5.8 \ \text{Hz}) \ \text{deg} \ (\text{deg}, \ J = 5.8 \ \text{Hz}) \ \text{deg} \ (\text{deg}, \ J = 5.8 \ \text{deg})$

出証特2005-3008820

```
.8 \text{ Hz}, .1 \text{H}), 7.22 - 7.35 \text{ (m)}, .6 \text{H}), .7.40 \text{ (s)}, .10 \text{ (d)}, .1
     MS(ESI^{+})m/z; 363[M+1]^{+}
     MS(ESI-)m/z; 407 [M+45] +
              [0538]
      合成例 5
     2, 2, 8-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノ
      リン-3-オール 2マレイン酸塩
              [0539]
                    【化41】
              [0540]
            合成例5は合成例4の方法に準拠して合成した。
              [0541]
      2,2,8-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン
               [0542]
                    【化42】
[0543]
        (収率17%)
      ^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \delta; 1.48(s, 6H), 2.45(s, 3H),5.87(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.56(d, J =
      9.9 Hz, 1H), 7.00(s, 1H), 7.64(s, 1H), 7.70(s, 1H), 8.54(d, J = 8.5 Hz, 1H)
      MS(ESI^{+})m/z; 226[M+1] +
               [0544]
       3-ブロモ-2, 2, 8-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-4-オール
                [0545]
                     【化43】
                [0546]
        (収率54%)
       MS(ESI^{+})m/z; 322,324 [M+1]^{+}
                [0547]
        2, 2, 8-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノ
        リン-3-オール 2マレイン酸塩
        (収率20%)
         白色結晶
        ^{1}H-NMR(DMSO-d6) \delta; 1.15(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.45(s, 3H), 2.97-3.39(m, 4H), 4.09
        (dd, J = 6.1 \text{ Hz}, 9.4 \text{ Hz}, 1\text{H}), 4.71(d, J = 9.1 \text{ Hz}, 1\text{H}), 6.15(s, 4\text{H}), 6.32(d, J = 6.1 \text{ Hz})
         .3 Hz, 1H),7.19-7.36(m, 5H), 7.97(s, 1H), 8.39(s, 1H), 8.67(s, 1H)
                [0548]
        合成例6
        7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,
         3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩
                 [0549]
```

【化44】

CI Ph OH CO₂H

[0550]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(1.56g, 6.92mmol)のクロロホルム溶液(1.56mL)に、室温でm-クロロ過安息香酸(2.61g, 15.2mmol)のクロロホルム(6.4nL)-メタノール(1.6mL)溶液を滴下し、室温で1.5時間攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、室温で残渣にクロロホルム(3mL)、パラトルエンスルホン酸塩化物(1.32g, 6.92mmol)、炭酸カリウム(0.954g, 6.92mmol)を加え、70Cで3時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、クロロホルムで抽出、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(0.4+サン/酢酸エチル=2/1)で精製し、目的物(収率6.5%)を得た。

[0551]

【化45】



[0552]

淡黄色固体

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ &; 1.42(s, 6H), 2.48(d, J= 0.8 Hz, 3H), 5.83(d, J= 9.9 Hz, 1H), 6.47(d, J= 9.9 Hz, 1H), 7.03(d, J= 3.6 Hz, 1H), 7.11(s, 1H), 7.50(s, 1H) MS(ESI^+)m/z; 260[M+1] $^{+}$

[0553]

3-ブロモ-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-4-オール

[0554]

【化46】



[0555]

以下、合成例1の方法を準拠して合成した。

(収率44%)

 $MS(ESI^{+})m/z$; 356, 358 [M+1] +

[0556]

7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(収率58%)

白色結晶

mp.;221-226℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ δ ; 1.17(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.93-3.32(m, 4H), 4.05 (m, 1H), 4.65(d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.28(br s, 1H), 7.22-7.34(m, 5H), 7.43(s, 2H), 8.32(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 397[M+1]^{+}$

MS(ESI-)m/z; 441 [M+45] +

[0557]

合成例7

3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

[0559]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル

[0560]

【化48】



[0561]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン (4.36g,19.3mmo1)のクロロホルム溶液 (4.36mL)に、室温でm-クロロ過安息香酸 (7.35g,42.6mmo1)のクロロホルム (17.4mL)-メタノール (4.36mL)溶液を滴下し、室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、室温で残渣にアセトニトリル (19.3mL)、トリメチルシリルニトリル (7.27mL,57.9mmo1)、トリエチルアミン (5.38mL,38.6mmo1)を加え、70 $\mathbb C$ で3.5時間攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、目的物 (収率55%))を得た。淡黄色固体

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDCl}_{3})$ δ ; 1.52(s, 6H), 2.62(d, J= 0.6 Hz, 3H), 5.97(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.58(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.23(s, 1H), 7.40(s, 1H), 7.71(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 251[M+1]^{+}$

[0562]

3-ブロモ-4-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-カルボニトリル

[0563]

【化49】



[0564]

以下、合成例1の方法を準拠し合成した。

(収率36%)

 $MS(ESI^{+})m/z; 349[M+1]^{+}$

[0565]

3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

白色結晶

mp.;218-220℃(分解)

 1 H-NMR(DMSO-d₆) δ ; 1.20(s, 3H), 1.51(s, 3H), 2.65(s, 3H), 2.96-3.33(m, 4H), 4.04 -4.06(m, 1H), 4.64(br s, 1H), 6.05(s, 2H), 6.29 (br s, 1H), 7.25-7.31(m, 5H), 7.5 0(s, 1H), 7.85(s, 1H), 8.49(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 388[M+1]^{+}$

MS(ESI-)m/z; 432 [M+45] +

[0566]

合成例 8

3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3,2-f]キノリン-2-オール

【0567】 【化50】

HN OH

[0568]

6-[(1,1-ジメチル-2-プロピニル)オキシ]キノリン

[0569]

【化51】



[0570]

2-メチル3-ブチン-2-オール(2.45mL, 25.1mmo1)、 1,8-ジアザビシクロ-[5,4,0]-7-ウンデセン(4.25mL, 28.4mmo1)のアセトニトリル溶液(15.5mL)を0°Cで30分攪拌し、無水トリフルオロ酢酸(3.55mL, 25.1mmo1)を滴下した。この混合液を、0°Cで6-ヒドロキシキノリン(2.43g, 16.7mmo1)、塩化銅(I)(8.3mg, 0.0835mmo1)、アセトニトリル(15.5mL)、1.8-ジアザビシクロ-[5,4,0]-7-ウンデセン(4.25mL, 28.4mmo1)の混合溶液に滴下し、0°Cで3時間攪拌した。1mo1/LHC1で酸性にし、酢酸エチルで抽出し、水層を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(へキサン/酢酸エチル=1/1~1/3)で精製し、目的物を得た

淡黄色結晶

mp.:65−67°C

 1 H-NMR(CDCl₃) δ ; 1.86(s, 6H), 2.70(s, 1H), 7.69-7.71(2H), 7.80(s, 1H), 8.33(d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.45(d, J = 8.3 Hz 1H), 9.01(br s, 1H)

MS(GC)m/z; 211 [M] +

[0571]

3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリン

[0572]

【化52】



[0573]

6-[(1,1-i)メチル-2-プロピニル)オキシ]キノリン (16.7mmol)の1,2-ジクロロベンゼン溶液(10mL)を180 $\mathbb C$ で1時間攪拌した。反応終了後、溶媒を留去し、残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、目的物(2段階quant.)を得た。

緑色結晶

mp.:104-107℃

 1 H-NMR(CDCl₃) δ ; 1.54(s, 6H), 5.89(d, J= 10.2 Hz, 1H), 6.93(d, J= 10.2 Hz, 1H), 7.50(d, J= 9.1 Hz, 1H), 7.73(br s, 1H), 8.31(d, J= 9.1 Hz, 1H), 8.74(d, J= 8.5 Hz, 1H), 9.03(br s, 1H)

MS(GC)m/z; 211[M] +

[0574]

3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3,2-f]キノリン-2-オール

以下、合成例1の方法に準拠し合成した。

白色結晶

mp.:180-182℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.32(s, 3H), 1.44(s, 3H),1.63(br s, 1H), 2.43(br s, 1H), 2.69–2.84(m, 3H), 2.92–2.97(m, 1H), 3.83(d, J= 5.0 Hz, 1H), 4.09(d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.10–7.29(m, 6H), 7.86(d, J= 9.1 Hz, 1H), 8.13(d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.71(dd, J =

出証特2005-3008820

```
1.7 Hz, 4.1Hz, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 349[M+1]^{+}
MS(ESI-)m/z; 393 [M+45] +
  [0575]
合成例9
8-クロロ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]
キノリン-2-オール
   [0576]
    【化53】
   [0577]
 3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリンを用い、合成例 6 と同様に合成した。
   [0578]
8-クロロ-3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリン
   [0579]
    【化54】
   [0580]
(収率82%)
赤褐色油状物
^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \delta; 1.49(s, 6H), 5.77(d, J= 9.9 Hz, 1H), 6.87(d, J= 9.9 Hz, 1H),
7.27(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.34(d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.80(d, J = 9.1 Hz, 1H), 8.19(d)
J = 8.8 Hz, 1H
MS(ESI^{+})m/z; 246[M+1] +
   [0581]
2-ブロモ-8-クロロ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-1-オール
   [0582]
     【化55】
   [0583]
 (収率45%)
   [0584]
8-クロロ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]
キノリン-2-オール
 (収率60%)
白色結晶
mp.:141-143℃
^{1}H-NMR(CDC1<sub>3</sub>) \delta; 1.28(s, 3H), 1.44(s, 3H), 1.64(br s, 2H), 2.65-2.78(m, 3H), 2.8
6-2.96(m, 1H), 3.84(d, J = 6.1 Hz, 1H), 4.06(d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.08-7.30(m, 7H)
 7.98(d, J = 9.1Hz, 1H), 8.22(d, J = 8.8 Hz, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 383[M+1]^{+}
MS(ESI-)m/z; 427 [M+45] +
   [0585]
 合成例10
```

2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-8-カルボニトリル [0586] 【化56】 [0587] 3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリンを用い合成例7と同様の方法で合成した。 [0588] 3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリン-8-カルボニトリル[0589]【化57】 [0590] (収率 quant.) 黄色固体 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.52(s, 6H), 5.80(d, J= 9.9 Hz, 1H), 6.89(d, J = 10.2 Hz, 1H), 7.37(d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.65(d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.95(d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.64(d, J = 9.4 Hz,d. J = 8.8 Hz, J = 10.8 Hz $MS(ESI^{+})m/z; 237[M+1]^{+}$ MS(ESI-)m/z; 235 [M-1] +[0591]2-ブロモ $_1$ -ヒドロキシ $_3$, 3-ジメチル $_2$, 3-ジヒドロ $_1$ H-ピラノ $_3$, 2- $_1$ 1 キノリン $_2$ 8-カル ボニトリル [0592]【化58】 [0593](収率49%) $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.50(s, 3H), 1.69(s, 3H),2.72(d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.35(d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.35(d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.35(d, J = 4.1 Hz, 1H), 7.2 Hz, 1H), 5.43 (dd, J = 3.9 Hz, 7.2 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 9.1 Hz= 8.8Hz, 1H), 8.03(d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.72(d, J = 8.5 Hz, 1H) $MS(ESI^{+})m/z$; 333,335 [M+1] ⁺ MS(ESI-)m/z; 379 [M+45] +[0594]2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-8-カルボニトリル (収率72%) 白色結晶 mp.:93-96℃ $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.30(s, 3H), 1.46(s, 3H),1.60(br s, 3H), 2.13(br s, 1H), 2.66-2.79(m, 3H), 2.88-2.98(m, 1H), 3.87(d, J=5.8 Hz, 1H), 4.08(d, J=6.1 Hz, 1H), 7.09(d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.10(d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.23-7.27(m, 3H), 7.30(d, J = 9.4 Hz, 1H).1 Hz, 1H), 7.41(d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.92(d, J = 9.1 Hz, 1H), 8.38(d, J = 8.5 Hz, 1Hz)

1H)

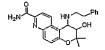
MS(ESI⁺)m/z; 374[M+1] ⁺ MS(ESI-)m/z; 418 [M+45] ⁺

[0595]

合成例11

2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-8-カルボキサミド

【0596】 【化59】



[0597]

2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-8-カルボキサミド

2-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3,2-f]キノリン-8-カルボニトリル(400mg,1.07mmol)のt-ブタノール溶液(40mL)に室温で水酸化カリウム(800mg,14.3mmol)を加え、90度で2時間攪拌した。反応終了後、反応液に塩化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、ヘキサン-酢酸エチルから再結晶することにより、目的物(収率54%)を得た。

白色結晶

mp.:197-199℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.32(s, 3H), 1.47(s, 3H),1.71(br s, 2H), 2.29(br s, 1H), 2.69–2.76(m, 3H), 2.89–2.97(m, 1H), 3.86(br s, 1H), 4.13(d, J = 5.8 Hz, 1H), 5.62(br s, 1H), 7.10(d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.10(d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.20–7.28(m, 4H), 7.89(d, J = 9.4Hz, 1H), 7.98(br s, 1H), 8.07(d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.31(d, J = 8.8Hz, 1H)

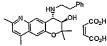
MS(ESI+)m/z; 392[M+1] + MS(ESI-)m/z; 436 [M+45] +

[0598]

合成例12

 $(3R^*,4S^*)$ -2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

【0599】 【化60】



[0600]

 $(3R^*, 4R^*)$ – 3, 4–エポキシ–2, 2, 7, 9–テトラメチル–3, 4–ジヒドロ–2H–ピラノ[2, 3–g]キノリン

【0601】 【化61】



[0602]

2,2,7,9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(4.64g,19.4mmol)の酢酸エチル溶液(70mL)に、室温でN-メチルイミダゾール(0.303mL,3.88mmol)、Ph,Ph サレンマンガン錯体(201mg,0.194mmol)を加え、水浴中、次亜塩素酸ナトリウム水溶液(25.6g,1.513mol/kg,38.8mmol)を滴下し、水浴中1時間攪拌した。さらに水浴中、次亜塩素酸ナトリウム水溶液(2

5.6g, 1.513mol/kg, 38.8mmol)を追加し、水浴中1時間攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、セライト濾過し抽出、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/3)で精製し、目的物(収率68%)を得た。

>99.9%ee CHIRALPAK AD-RH 20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40 保持時間 5.7分

 1 H-NMR(CDC1₃) δ ; 1.30(s, 3H), 1.64(s, 3H), 2.56(s, 3H), 2.66(s, 3H), 3.59(d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.14(d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 7.29(s, 1H), 8.04(s, 1H) MS(ESI⁺)m/z; 256[M+1] $^{+}$

[0603]

 $(3R^*,4S^*)$ -2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-7x-1)x+1)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

 $(3R^*,4S^*)$ -3,4-エポキシ-2,2,7,9-テトラメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(0.80g,3.14mmol)の1,4-ジオキサン溶液(1.6mL)に、室温で過塩素酸リチウム(334mg,3.14mmol)、フェニルエチルアミン(0.473mL,3.77mmol)を加え、70℃で1時間攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)で精製し、溶媒を留去後、酢酸エチル(2mL)を加え、マレイン酸(376mg,3.23mmol)の酢酸エチル溶液(8mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで目的物(収率86%)を得た。

白色結晶

mp.;215-219℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ δ ; 1.16(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.55(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.93-3.39 (m, 4H), 4.07(dd, J = 6.4 Hz, 9.4Hz, 1H), 4.64(d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.27(d, J = 5.8Hz, 1H), 7.24-7.26(m, 4H), 7.30(s, 1H), 7.33(s, 1H), 7.36(s, 1H), 8.31(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 377[M+1]^{+}$

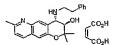
MS(ESI-)m/z; 421 [M+45] +

[0604]

合成例13

(3R*,4S*)-2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

【0605】 【化62】



[0606]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0607]

(3R*, 4R*)-3, 4-エポキシ-2, 2, 7-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン

【0608】 【化63】



[0609]

99.3%ee CHIRALPAK AD-RH20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40保持時間 6.2分

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.28(s, 3H), 1.64(s, 3H), 2.71(s, 3H), 3.59(d, J = 4.4 Hz, 1H),

4.15(d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.13(s, 1H), 7.23(d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.91(d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.05(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 242[M+1]^{+}$

[0610]

 $(3R^*, 4S^*)$ -2, 2, 7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アニー

白色結晶

mp.; 214-217℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ δ ; 1.15(s, 3H), 1.48(s, 3H), 2.62(s, 3H), 2.93-3.14 (m, 4H), 4.0 3-4.07(m, 1H), 4.61(br s, 1H), 6.04(s, 2H), 6.23(br s, 1H), 7.23-7.39(m, 7H), 8.0 9(d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.31(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 363[M+1]^{+}$

MS(ESI-)m/z; 407 [M+45] +

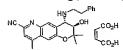
[0611]

合成例14

(3R*,4R*)-3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

[0612]

【化64】



[0613]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0614]

(3R*,4R*)-3,4-エポキシ-3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル

[0615]

【化65】



[0616]

(収率33%)

99.1%eeCHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3 保持時間18.6分

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDCl}_{3})$ δ ; 1.33(s, 3H), 1.66(s, 3H),2.65(s, 3H), 3.64(d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.17(d, J = 4.4 Hz, 1H),7.33(s, 1H), 7.47(s, 1H), 8.18(s, 1H)

MS(ESI⁺)m/z; 267[M+1] ⁺ MS(ESI-)m/z; 265 [M-1] ⁺

[0617]

 $(3R^*,4S^*)$ -3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

(収率23%)

淡褐色結晶

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ δ ; 1.20(s, 3H), 1.52(s, 3H), 2.66(s, 3H), 2.98-3.33(m, 4H), 4.09 (m, 1H), 4.71(br s, 1H), 6.09(s, 2H), 6.33(br s, 1H), 7.23-7.34(m, 5H), 7.51(s, 1H), 7.86(s, 1H), 8.51(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 388[M+1]^{+}$

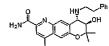
MS(ESI-)m/z; 432 [M+45] +

[0618]

合成例 1 5

 $(3R^*,4S^*)$ -3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボキサミド

【0619】 【1比66】



[0620]

合成例 1 1 と同様の方法により (3R*,4S*) -3 - ヒドロキシ-2, 2, 9 - トリメチル-4 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] -3, 4 - ジヒドロ-2H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン-7 - カルボニトリルから合成した(収率9%)。

白色結晶

mp.; 168-169℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.26(s, 3H), 1.57(s, 3H),1.83(br s, 3H), 2.65(s, 2H), 2.90-3.1 6(m, 4H), 3.66(d, J = 10.2 Hz, 1H),3.95(d, J = 10.5 Hz, 1H), 5.61(br s, 1H), 7.2 4-7.36(m, 5H), 7.85(s, 1H),8.00(br s, 1H), 8.04(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 406[M+1]^{+}$

MS(ESI-)m/z; 450 [M+45] +

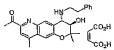
[0621]

合成例 1 6

 $(3R^*,4S^*)$ - $\{3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル<math>\}$ エタノン 1マレイン酸塩

[0622]

【化67】



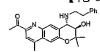
[0623]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0624]

 $(3R^*, 4S^*)$ -[3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-イル]エタノン

【0625】 【化68】



[0626]

[0627]

 $(3R^*,4S^*)$ – $\{3-$ ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル} エタノン 1マレイン酸塩

(3R*,4S*)- ${3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル}エタノン(31.3mg,0.077mmo1)の酢酸エチル溶液(2mL)にマレイン酸(10.0mg,0.086mmo1)の酢酸エチル溶液(2mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで、目的物(収率80%)を得た。$

白色結晶

mp.;230-234℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ δ ; 1.18(s, 3H), 1.51(s, 3H), 2.66(s, 3H), 2.74(s, 3H), 2.98-3.34(m, 4H), 4.10(m, 1H), 4.66(br s, 1H), 6.05(s, 2H), 6.29(br s, 1H), 7.25-7.36(m, 5H), 7.48(s, 1H), 7.87(s, 1H), 8.56(s, 1H)

[0628]

合成例17

 $(1R^*, 2R^*)$ -3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル) アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]1キノリン-2-オール

【0629】 【化69】



[0630]

合成例12の方法を準拠して合成した。

(収率2段階4%)

白色結晶

mp.; 170-171℃

 $\begin{array}{l} ^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \quad \delta \; ; \; 1.31 \, (\text{s}, \; 3\text{H}), \; 1.45 \, (\text{s}, \; 3\text{H}), 1.61 \, (\text{br s}, \; 6\text{H}), \; 2.71-2.84 \, (\text{m}, \; 3\text{H}), \; 2.9 \\ 1-2.97 \, (\text{m}, \; 1\text{H}), \; 3.83 \, (\text{d}, \; \text{J} = 5.5 \, \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 4.11 \, (\text{d}, \; \text{J} = 5.5 \, \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 7.12 \, (\text{d}, \; \text{J} = 7.98 \, \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 7.18-7.25 \, (\text{m}, \; 5\text{H}), \; 7.90 \, (\text{d}, \; \text{J} = 9.1 \, \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 8.15 \, (\text{d}, \; \text{J} = 8.5 \, \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 8.73 \, (\text{dd}, \; \text{J} = 1.4 \, \text{Hz}, \; 4.1 \, \text{Hz}, \; 1\text{H}) \\ \end{array}$

 $MS(ESI^{+})m/z; 349[M+1]^{+}$

MS(ESI-)m/z; 393 [M+45]

エポキシ体 97.1%eeCHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3保持時間7.0分

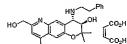
[0631]

合成例18

 $(3R^*,4S^*)$ -7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

[0632]

【化70】



[0633]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0634]

(2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル)-メチルアセテート

[0635]

【化71】



[0636]

2,2,7,9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(3.0g,12.5mmol)のクロロホルム溶液(30.0mL)に、室温でm-クロロ過安息香酸(4.76g,27.6mmol)のクロロホルム(12mL)-メタノール(3mL)溶液を滴下し、室温で30分攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、室温で残渣に無水酢酸(12mL)を加え、150Cで1時間攪拌した。反応終了後、無水酢酸を留去し、炭酸ナトリウム水溶液で中和し、クロロホルムで抽出、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、中圧カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、目的物(収率64%)を得た。

黑色油状物

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ &; 1.50(s, 6H), 2.17(s, 3H), 2.61(s, 3H), 5.30(s, 2H), 5.90(d, J = 9.91 Hz, 1H), 6.57(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.19(s, 1H), 7.24(s, 1H), 7.70(s, 1H) MS(ESI+)m/z; 298[M+1] +

[0637]

 $(3R^*, 4R^*)$ $_-(3, 4$ $_-$ エポキシ $_-2, 2, 9$ $_-$ トリメチル $_-3, 4$ $_-$ ジヒドロ $_-2H$ $_-$ ピラノ[2, 3 $_-g]$ キノリン $_-7$ $_-$ イル) $_-$ メチルアセテート

[0638]

【化72】

[0639]

(収率77%)

>99.9%ee CHIRALPAK AD-RH20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40保持時間 5.4分

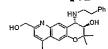
 $MS(ESI^{+})m/z;314 [M+1]^{+}$

[0640]

(3R*, 4S*)-7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール

[0641]

【化73】



[0642]

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.24(s, 3H), 1.55(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.87–3.08(m, 5H), 3.63(d , J = 10.2 Hz, 1H), 3.81(d, J= 10.5 Hz, 1H), 4.82(s, 2H), 7.02(s, 1H), 7.23–7.36 (m, 6H), 7.75(s, 1H) MS(ESI^+)m/z;393 [M+1] $^{+}$

MS(ESI-)m/z; 437 [M+45] +

[0643]

 $(3R^*, 4S^*)$ -7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(3R*, 4S*)-7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4

-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール(157mg,0.407mmo1)の酢酸エチル溶液(4mL)に、マレイン酸(52mg,0.448mmo1)の酢酸エチル溶液(2mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで目的物(収率80%)を得た。

淡黄色結晶

mp.; 216-221℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ &; 1.17(s, 3H),1.50(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.98-3.40(m, 4H), 4.06 -4.11(m, 1H), 3.81(d, J= 10.5 Hz, 1H), 4.66-4.69(3H), 5.50(br s, 1H), 6.06(s, 2H), 6.30(br s, 1H),7.23-7.35(m, 5H), 7.40(s, 1H), 7.47(s, 1H), 8.35(s, 1H)

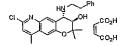
[0644]

合成例 19

(3R*,4S*)-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

[0645]

【化74】



[0646]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0647]

 $(3R^*, 4R^*)$ -7-クロロ-3, 4-エポキシ-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン

[0648]

【化75】



[0649]

(収率78%)

99.1%eeCHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3保持時間18.9分

黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.28(s, 3H), 1.65(s, 3H), 2.59(d, J = 0.8 Hz, 3H), 3.60(d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.13(d, J= 4.4 Hz, 1H), 7.19(s, 1H), 7.29(d, 1H), 8.02(s, 1H) MS(ESI⁺)m/z; 276[M+1] ⁺

[0650]

(3R*,4S*)-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(2段階 収率34%)

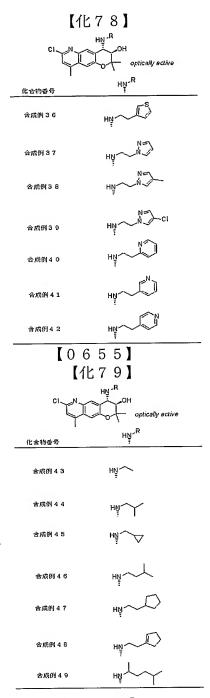
[0651]

合成例20-49

合成例20から合成例49は合成例19と同様の方法で合成した。

[0652]

【化76】	
CI NHN-R OH optically active	
化合物番号	HÅ _L B
合成例20	нй
含成例 2 1	HN O
合成例22	HÅ
合成例23	HŅ F
合成例 2 4	ну
合成例25	HŅ
含成例26	HŅ NH2
合成例27	нй он
合成例26	HÀ
合成例29	HN



[0656]

合成例20

(収率81 %)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.60 (br s, 1H), 2.60 (s, 3H), 3.1 2 (s, 1H), 3.72 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.85-4.00 (m, 2H), 7.17 (s, 1H), 7.30-7.40 (m, 6H), 8.08 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;383 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;427[M+45]^{+}$

[0657]

合成例 2 1

(収率 92%)

淡黄色無定形物

 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.28 (s, 3H), 1.57 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 3.70 (d, J = 10.3 Hz , 1H), 3.82 (Abq, J = 12.8 Hz, 2H), 3.97 (dd, J = 10.3, 1.2 Hz, 1H), 5.96 (s, 2H) , 6.77 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 1.6 Hz, 1 H), 7.13 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 8.04 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;427 [M+1]^{+}$

[0658]

合成例 2 2

(3R*, 4S*) - 7クロロー 2, 2, 9 ートリメチルー4ー[(3-フェニルプロピル) アミノ] - 3, 4 - ジヒドロー <math>2H ーピラノ [2, 3-g] キノリンー 3 ーオール

(収率72%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 1.28 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.80-1.95 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.65-2.85 (m, 5H), 3.24 (s, 1H), 3.61 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 7.10-7.20 (m, 3H), 7.25-7.35(m, 3H), 7.94 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;411 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;455 [M+45]^{+}$

[0659]

合成例 2 3

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2 - (4 - フルオロフェニル) エチル] アミノ \} - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 - オール (収率 96 %)$

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 1.25 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.57 (br s, 1H), 2.58 (s, 3H), 2.8 0 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.90-3.10 (m, 3H), 3.58 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.4 Hz, 1H),6.95-7.05 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 3H), 7.26 (s, 1H), 7.89 (s, 1H). MS (ESI^+) m / z;415 [M+1]^+

[0660]

合成例 2 4

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2-(2-フルオロフェニル)エチル]アミノ\} - 2, 2, 9 - トリメチル-3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 - オール (収率 79 %)$

無色無定形物

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.25 (s, 3H), 1.54 (s, 3H),1.61 (br s, 1H), 2.57 (s, 3H), 2.8 6 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.95-3.10 (m, 3H), 3.56 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.85 (d, J = 10.4 Hz, 1H),7.00-7.25 (m, 6H), 7.90 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;415 [M+1]^{+}$

[0661]

合成例 2 5

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2 - (4 - クロロフェニル) エチル] アミノ - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール (収率 78 %)$

無色無定形物

[0662]

合成例 2 6

出証特2005-3008820

```
トリメチルー3, 4ージヒドロー2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール
 (収率 40 %)
無色無定形物
^{1}\text{H-NMR} (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.23 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.58 (br s, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.7
1 (t, J = 7.4 \text{ Hz}, 2H), 2.85-3.05 (m, 2H), 3.11 (br s, 1H), 3.57 (d, J = 10.4 \text{ Hz},
1H), 3.84 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 6.65 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.5 Hz, 2H)
),7.11 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.81 (s, 1H).
MS (ESI^{+}) m / z;412 [M+1]^{+}
MS (ESI^{-}) m / z;456 [M+45]^{+}
   [0663]
合成例 2 7
9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ [2, 3-g] キノリンー3-オール
 (収率72%)
無色無定形物
^{1}\text{H-NMR} (CDCl<sub>3</sub>) \delta: 1.27 (s, 1.5H), 1.28 (s,1.5H), 1.56 (s, 3H), 1.77 (br s, 2H),
2.57 (s, 3H), 2.85-3.15 (m, 2H), 3.68 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.75 (d, J = 10.2 Hz,
 1H), 4.75-4.85 (m, 1H), 7.25(s, 1H), 7.27-7.40 (s, 6H), 7.99 (s, 0.5H), 8.00 (s
0.5H.
MS (ESI^{+}) m / z;413[M+1]^{+}
MS (ESI^{-}) m / z;457[M+45]^{+}
   [0664]
合成例 2 8
 (3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - (2 - フェニルブチル) アミノー2,2,9 - トリ
 メチルー3、4-ジヒドロー2H-ピラノ[2,3-g]キノリンー3-オール
 (収率 50%)
淡褐色無定形物
^{1}\text{H-NMR} (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 0.86 (t, J = 7.3 Hz,3H), 1.20 (s, 3H), 1.53 (s, 3H), 1.51-1.7
1 \text{ (m, 2H), } 2.57 \text{ (s, 3H), } 2.57-2.64 \text{ (m, 1H), } 2.86 \text{ (dd, } J = 11.6, 9.1 Hz, 1H), } 2.86
 (dd, J = 11.6, 5.2 \text{ Hz}, 1\text{H}), 3.55 (d, J = 10.2 \text{ Hz}, 1\text{H}), 3.74 (d, J = 10.2 \text{ Hz}, 1\text{H})
 , 7.15(s, 1H), 7.20-7.32 (m, 4H), 7.38 (dd, J = 7.1, 7.1 Hz, 2H), 7.74 (s, 1H)
MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;425 [M+1]<sup>+</sup>
   [0665]
 合成例 2 9
 (3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - \{[2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル
) エチル] アミノ\}-2,2,9-トリメチルー3,4-ジヒドロー2H-ピラノ [2,3-
 g] キノリン-3-オール
  (収率 62%)
 淡褐色無定形物
 ^{1}\text{H-NMR} (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.26 (s, 3H), 1.56 (s, 3H),1.66 (br, 1H), 2.57 (s, 3H), 2.74
 (t, J = 6.9 \text{ Hz}, 2H), 2.89-3.00 \text{ (m, 2H)}, 3.1 \text{ (br, 1H)}, 3.60 \text{ (d, } J = 10.4 \text{ Hz}, 1H),
 3.86 (d, J = 10.4Hz, 1H), 5.95 (Abq, 2H), 6.66-6.77 (m, 3H), 7.15 (s, 1H), 7.26
 (s. 1H), 7.83(s, 1H)
 MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;441 [M+1]<sup>+</sup>
    [0666]
 合成例30
 (3R*, 4S*) - 7 - クロロー2, 2, 9 - トリメチルー4 - {[2 - (1 - ピペリジニル)エチル
 ]アミノ\}-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール
  (収率61 %)
```

淡黄色無定形物

 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.60 (br s, 2H), 1.50-1.70 (m, 6H) 2.30-2.60 (m, 6H), 2.58 (s, 3H), 3.06 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 3.54 (d, J = 10.4 Hz , 1H), 3.80 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 8.06 (s, 1H). $MS (ESI^{+}) m / z;404 [M+1]^{+}$ $MS (ESI^{-}) m / z;448 [M+45]^{+}$ [0667] 合成例31 [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g]ール (収率55%) 無色無定形物 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.49-2.00 (m, 8H), 2.10-2.25 (m, 2 H), 2.34 (s, 1.5H), 2.35 (s, 1.5H), 2.58 (s,3H), 2.65-2.85 (m, 2H), 3.00-3.15 (m , 1H), 3.62 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 3.70 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 3.85 (d, J = 10.44 Hz, 0.5H), 3.88(d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 7.15(s, 1H), 7.27(s, 1H), 7.96(s, 1H)). MS (ESI⁺) m / z;404 $[M+1]^+$ $MS (ESI^{-}) m / z;448 [M+45]^{+}$ [0668]合成例32 $(3R^*, 4S^*)-4-[(2-ry-1)x+w)r=1]-7-2pq-2,2,9-1y+w$ (収率78%) 淡黄色無定形物 ¹H-NMR (CDC1₃) δ : 1.27 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.77 (br s, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.9 5-3.10 (m, 2H), 3.30 (t, J = 5.5 Hz, 2H), 3.64 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.93 (d, J = 10.2 Hz), 3.93 (d, J = 10.2 Hz), 3.93 (d, J = 10.2 Hz), 3.93 (d, J = 10.2 Hz) 10.2 Hz, 1H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.20 (m, 3H), 7.28 (s, 1H), 7.98 (s, 1H). MS (ESI⁺) m / z:412 $[M+1]^+$ $MS (ESI^{-}) m / z;456 [M+45]^{+}$ [0669]合成例33 $(3R^*, 4S^*) - 7 - 9 - 9 - 4 - ([2-[x+y(3-x+y)]x+y)]x + [3-x+y]x ノ) -2, 2, 9 - トリメチル -3, 4 - ジヒドロ -2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3ーオール (収率90%) 淡黄色無定形物 ¹H-NMR (CDC1₃) δ : 1.23 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 1.62 (br s, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.80-3.00 (m, 2H), 3.30-3.50 (m, 5H), 3.61 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 3.91(d, J = 10.1 Hz, 1H), 6.60-6.70 (m, 4H), 7.05-7.15 (m, 2H), 7.96 (s,1H). $MS (ESI^{+}) m / z;454 [M+1]^{+}$ $MS (ESI^{-}) m / z;498 [M+45]^{+}$ [0670] 合成例34 ロリジニル)メチル]アミノ|-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリンー 3ーオール (収率 93%)

淡黄色無定形物

 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.27 (s, 1H), 1.32 (t, J= 7.1 Hz, 2H), 1.56 (s, 3H), 1.95-2.1 2 (br, 4H), 2.56 (s, 3H), 2.71-2.81 (br, 2H), 2.98-3.37 (m, 4H), 3.64-4.01 (m, 5H) , 7.12 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 8.01 (s,1H) MS (ESI⁺) m / z;405 [M+1]⁺ $MS (ESI^{-}) m / z;448 [M+45]^{+}$ [0671]合成例35 (3R*, 4S*) - 7 - クロロー2,2,9 - トリメチルー4 - [(2,2-ジエトキシエチル) [7] アミノ] [2] - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2] - 3 - g] キノリンー 3 - オール マレイ ン酸塩 (88%収率) 白色固体 1 H-NMR (CD₃OD) δ : 1.23-1.30 (m, 9H), 1.57 (s,3H), 2.64 (s, 3H), 3.50-3.85 (m, 4) H), 4.02 (d, J = 10.2 Hz, IH), 6.27(s, IH), 7.37 (s, IH), 7.49 (s, IH), 8.13 (s, 1H) [0672]フリー体 $(3R^*, 4S^*) - 7 - 0 - 2 - 2 - 2 - 9 - 1 - 1 - 4 - [(2, 2 - 3 - 1 + 2 - 2 - 2)]$ $r \in J] - 3$, 4 - ジヒドロ - 2H - ピラノ [2,3 - g] キノリン - 3 - オール淡黄色無定形物 $MS (ESI^{+}) m / z;410 [M+1]^{+}$ $MS (ESI^{-}) m / z;453 [M+45]^{+}$ [0673] 合成例36 (収率 57%) 淡黄色無定形物 ¹H-NMR (CDCl₃) δ : 1.24 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.56 (s, 3H), 2.84 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.90-3.09 (m, 2H), 3.60 (d, J=10.5 Hz, 1H), 3.86 (d, J=10.5 Hz, 1H), 6.94-7.01 (m, 2H), 7.13 (s, 1H), 7.24-7.29 (m, 2H), 7.89 (s, 1H) $MS (ESI^{+}) m / z;404 [M+1]^{+}$ $MS (ESI^{-}) m / z;447 [M+45]^{+}$ [0674]合成例37 , 9 ートリメチルー3, 4 ージヒドロー 2 Hーピラノ「2, 3-g] キノリンー 3 ーオール (収率 59%) 淡黄色無定形物 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.86 (br), 2.57 (s, 3H), 3.26-3.31 (m, 2H), 3.63 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 4.24-4.32 (m, 2H), 5.0 (br), 6.32 (dd, J = 1.7, 1.7 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.45 (d, J = 1.7 Hz, 1H, 7.58 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H) $MS (ESI^{+}) m / z;387 [M+1]^{+}$ [0675] 合成例38 $[\nu]$ アミノ $[-2, 2, 9-\nu]$ メチルー3. $[4-\nu]$ ビドロー2 Hーピラノ $[2, 3-\nu]$ キ ノリンー3ーオール

(収率 70%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 2.0 (br), 2.10 (s, 3H), 2.57 (s, 3 H), 3.16–3.31 (m, 2H), 3.64 (d, J =10.2 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 4.11 –4.30 (m, 2H), 5.2 (br), 7.13 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.98 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;401 [M+1]^{+}$

[0676]

合成例39

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2 - (4 - クロロピラゾールー1 - イル) エチル] アミノ<math>\} - 2, 2, 9 -$ トリメチルー3, 4 -ジヒドロー 2H -ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 -オール

(収率 89%)

淡黄色無定形物

¹H-NMR (CDC1₃) δ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.84 (br), 2.58 (s, 3H), 3.26-3.29 (m, 2H), 3.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H),3.87 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 4.16-4.29 (m, 2H), 4.51 (br, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.97 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;421 [M+1]^{+}$

[0677]

合成例 4 0

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (2 - ピリジルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール (収率 83%)

黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.32 (s, 3H), 1.61 (s, 3H),1.82 (br), 2.57 (s, 3H), 2.92–3.12 (m, 2H), 3.26–3.30 (m, 2H), 3.74 (d, J= 10.2 Hz, 1H), 3.92 (d, J= 10.2 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.17–7.27 (m, 3H), 7.64–7.70 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 8.56 (d, J= 5.0 Hz, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;398 [M+1]^{+}$

[0678]

合成例 4 1

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (3 - ピリジルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル-3, 4 - ジヒドロ-2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 - オール (収率 61%)

褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl3) δ : 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.73 (br), 2.58 (s, 3H), 2.80–2.85 (m, 2H), 2.92–3.07 (m, 2H), 3.23 (br), 3.61(d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.89 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H),7.22–7.27 (m, 2H), 7.55 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.47–8.48 (m, 2H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;398 [M+1]^{+}$

[0679]

合成例 4 2

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (4 - ピリジルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール (収率 47%)

淡褐色無定形物

¹H-NMR (CDC1₃) δ : 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.89 (br), 2.58 (s, 3H), 2.80-2.85 (m, 2H), 2.94-3.11 (m, 2H), 3.6 (br), 3.63(d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.90 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (d, J= 5.7 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.47 (d, J=5.7 Hz, 2H)

```
MS (ESI^{+}) m / z;398 [M+1]^{+}
   [0680]
合成例 4 3
 (収率 95%)
```

ジヒドロー2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール

淡黄色無定形物 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.18 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.68-2.91 (m, 2H), 3.63 (d, J=10.4 Hz, 1H), 3.87 (dd, J=10.4, 1.2 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 1.1Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.93 (d, J = 1.1 Hz, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;321 [M+1]^{+}$

[0681]

合成例 4 4

4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール

(収率 96 %)

淡褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 0.94-0.98 (m, 6H), 1.29 (s,3H), 1.58 (s, 3H), 1.68-1.76 (m, 1) H), 2.50-2.62 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 3.36(br, 1H), 3.63 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.6388 (dd, J = 10.2, 1.1 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.93 (s, 1H) $MS (ESI^{+}) m / z;239 [M+1]^{+}$

[0682]

合成例 4 5 トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール (収率 85 %)

淡褐色無定形物

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 0.13-0.20 (m, 2H), 0.48-0.54(m, 2H), 0.95-1.01 (m, 1H), 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.8 (br, 1H), 2.53 (m, 1H), 2.58 (s, 3H), 2.70 (m, 1H), 3. 63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7 .90 (s. 1H)

MS (ESI⁺) m / z;347 [M+1]⁺

[0683]

合成例 4 6

4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール

(収率 64 %)

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 0.90 (d, 6H), 1.29 (s, 3H), 1.39-1.46 (m, 2H), 1.58 (s, 3H), 1 .62-1.74 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 2.64-2.85 (m, 2H), 3.64 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.8 $7 \text{ (d, } J = 10.4 \text{ Hz, } 1\text{H), } 7.15(\text{s, } 1\text{H}), \ 7.28 \text{ (s, } 1\text{H), } 7.93 \text{ (s, } 1\text{H)}$ MS (ESI⁺) m / z;363 [M+1]⁺

[0684]

合成例47

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (シクロペンチルエチル) アミノ] - 2,2, 9 - トリメチル- 3 , 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン- 3 - オール (収率 78%)

淡黄色固体

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.08-1.11 (m, 2H), 1.29 (s,3H), 1.49-1.62 (m, 6H), 1.54 (s, 3) H), 1.71-1.83 (m, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.67-2.82 (m, 2H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H)

出証特2005-3008820

, 3.86 (d, J = 10.4Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.93 (s, 1H) $MS (ESI^{+}) m / z;389 [M+1]^{+}$

[0685]

合成例 4 8

(3R*, 4S*) -7-クロロ-4-[2-(1-シクロペンテニルエチル) アミノ] -2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2 Hーピラノ [2,3-g] キノリンー3ー オール

(収率 70 %)

淡褐色無定形物

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.86-1.94(m, 2H), 2.22-2.34 (m, 7) H), 2.58 (s, 3H), 2.79-2.96 (m, 2H), 3.63 (d, J=10.5 Hz, 1H), 3.87 (dd, J=10.55, 1.2 Hz, 1H), 5.44 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.92 (s, 1H) $MS (ESI^{+}) m / z;387 [M+1]^{+}$

[0686]

合成例 4 9

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-2, 2, 9 - トリメチル-4 - [(1, 4-ジメチルペンチル)]アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール (収率 83%)

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 0.91 (dd, J = 6.6 Hz, 9.6Hz, 6H), 1.13-1.34 (m, 9H), 1.56 (s, 6) $\rm H)$, 2.57 (s, $\rm 3H)$, 3.22-3.44 (m, $\rm 2H)$, 3.80-3.85 (br, $\rm 1H)$, 7.14 (s, $\rm 1H)$, 7.26 (s, $\rm 1H$) H), 7.96-7.98 (br, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;392 [M+2]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;435 [M+45]^{+}$

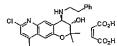
[0687]

合成例 5 0

(3S*, 4R*)-7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

[0688]

【化80】



[0689]

合成例50はPh,Phサレンマンガン錯体(XX)の反対のエナンチオマー(以下、ent-Ph ,Phサレンマンガン錯体と記載)を用い合成した。

[0690]

(3S*, 4S*)-7-クロロ-3, 4-エポキシ-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キ ノリン

[0691]

【化81】



[0692]

7-クロロ-2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(200mg,0.77mmol)の酢酸エチル 溶液(3.0mL)に、室温でN-メチルイミダゾール(0.012mL, 0.154mmol)、ent-Ph,Phサレンマ ンガン錯体(8.0mg, 0.0077mmol)を加え、水浴中、次亜塩素酸ナトリウム水溶液(1.0g, 1 .513mol/kg, 1.54mmol)を滴下し、水浴中40分攪拌した。水浴中、次亜塩素酸ナトリウム 水溶液(1.0g, 1.513mol/kg, 1.54mmol)を滴下し、水浴中、さらに30分攪拌した。反応終 了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、セライト濾過し抽出、有機層を炭酸水 素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=10/1)で精製し、(3S*,4S*)-7-クロロ-3,4-エポキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(収率94%)を得た。(>99.9%ee CHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3 保持時間44.3分)

[0693]

- (3S*,4R*)-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(3S*,4S*)-7-クロロ-3,4-エポキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g] キノリン(199mg,0.72mmol) の1,4-ジオキサン溶液(0.4mL)に、室温で過塩素酸リチウム(77.0mg,0.72mmol)、フェネチルアミン(0.11mL,0.87mmol)を加え、70℃で3時間攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、中圧カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、溶媒を留去後、酢酸エチル(2mL)を加え、マレイン酸(50.3 mg,0.43mmol)の酢酸エチル溶液(2mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで(3S*,4R*)-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩(収率41%)を得た。

白色結晶

mp.;240-242℃

 $^{1}\text{H-NMR}(DMSO-d6)$: 1.18(s, 3H),1.50(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.97-3.32(m, 4H), 4.04-4.09(m, 1H), 4.65(d, J= 9.6 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.29(br s, 1H), 7.23-7.35(m, 5H), 7.44(s, 2H),8.32(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z;397 [M+1]^{+}$

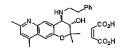
MS(ESI-)m/z;441 [M+45] +

[0694]

合成例 5 1

 $(3S^*, 4R^*)$ -2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

【0695】 【化82】



[0696]

合成例51は合成例50と同様の方法により合成した。

(2段階収率25%)

エポキシ99.1%ee CHIRALPAK AD-RH 20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40 保持時間 10.3分

白色結晶

mp.;215-216℃(分解)

¹H-NMR(DMSO-d6); 1.16(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.55(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.97-3.32 (m, 4H), 4.02-4.04(m, 1H), 4.62(br s, 1H), 6.04(s, 2H), 6.25(br s, 1H), 7.24-7.36(m, 7H), 8.31(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z;377 [M+1]^{+}$

[0697]

合成例 5 2

(3R*, 4S*) - 7 - クロロー2, 2, 9 - トリメチルー4 - (ペンチルアミノ) - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 - オール 塩酸塩

[0698]

【化83】

[0699]

(3R*, 4S*)-4-アミノ-7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール

[0700]

【化84】



[0701]

(3R*,4R*)-7-クロロ-3,4-エポキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g] キノリン(2.0g,7.25mmol)のエタノール溶液(20mL)にアンモニア水(10mL)を加え、封管中、90℃で3時間加熱攪拌した。反応終了後、濃縮し、酢酸エチルを加え、水、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で精製し、目的物(86%収率)を得た。

白色固体

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$ δ ; 1.30 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.67 (br s, 2H), 2.59 (s, 3H), 3.28 (br s, 1H), 3.45 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.85(d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 8.02 (s, 1H).

[0702]

[0703]

【化85】



[0704]

(3R*, 4S*) -4-アミノ-7-クロロー2, 2, 9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ [2, 3-g] キノリンー3ーオール(60 mg, 0.205mmo1)のメタノール溶液(1.2 mL)にブチルアルデヒド <math>(35mg, 0.0.41 mmo1)を加え、室温で20分攪拌した。ナトリウムシアノボロヒドリド(52mg, 0.82 mmo1)を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、目的物(収率41%)を得た。

無色無定形物

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 0.90 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.29 (s, 3H), 1.20-1.45 (m, 4H), 1.5 5-1.70 (m, 4H), 2.58 (s, 3H), 2.60-2.82 (m, 2H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.93 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;363 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;407 [M+45]^{+}$

[0705]

 $(3R*, 4S*) - 7 - 2 \pi - 2, 2, 9 - 1$ リメチルー $(3R*, 4S*) - 7 - 2 \pi - 2, 2, 9 - 1$ リンー $(3R*, 4S*) - 2 \pi - 2 \pi - 2$ [2, 3 - g] キノリンー $(3R*, 4S*) - 2 \pi - 2 \pi - 2$ [2, 3 - g] キノリンー $(3R*, 4S*) - 2 \pi - 2 \pi - 2$ [2, 3 - g] キノリンー $(3R*, 4S*) - 2 \pi - 2$ [2, 3 - g] キノリンー $(3R*, 4S*) - 2 \pi - 2$ [2, 3 - g] キノリンー $(3R*, 4S*) - 2 \pi - 2 \pi - 2$ [2, 3 - g] キノリンー $(3R*, 4S*) - 2 \pi - 2 \pi - 2 \pi - 2$ [3, $4 - 2 \pi -$

で15分攪拌した. 固形物を濾取し、エーテルで洗浄、乾燥し、目的物(収率 88 %)を得た

無色結晶

mp.: 291-294℃ (分解)

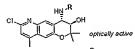
[0706]

合成例 5 3 - 5 7

合成例53から合成例57の化合物は合成例52の方法に従い合成した。

[0707]

【化86】



化合物番号	нұ. ^R
合成例53	нй нсі
会成例54	нå на
合成例55	нй
合成例5 6	HN CI
合成例 5 7	HÅ

[0708]

合成例 5 3

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - [(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチルー3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール 塩酸塩

フリー体

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - [(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル-3, 4 - ジヒドロ-2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 - オール (収率 31 %)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl3) δ : 0.90–1.00 (m, 2H), 1.05–1.25(m, 6H), 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3 H) 1.60–1.70 (m, 7H), 2.58 (s, 3H), 2.75–2.85(m, 2H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.93 (s, 1H)

[0709]

塩酸塩

(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - [(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチルー3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール 塩酸塩

(収率76%)

無色結晶

mp.:294-295℃ (分解)

 $MS (ESI^{+}) m / z;403 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;447 [M+45]^{+}$

[0710]

合成例 5 4

フリー体

(3R*, 4S*) -7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-テトラヒドロ-2 H-ピラン-4-イルエチル) アミノ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール

(収率 65%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.29 (s, 3H), 1.20-1.40 (m,4H), 1.58 (s, 3H), 1.50-1.80 (m, 4) H), 2.59 (s, 3H), 2.65-2.90 (s, 2H), 3.20-3.40 (m, 3H), 3.64 (d, J=10.4 Hz, 1H) , 3.70-3.75 (m, 1H), 3.85(d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.80-4.00 (m, 3H), 7.16 (s, 1H), 7.28 (s. 1H), 7.92 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;405 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;449 [M+45]^{+}$

[0711]

塩酸塩

H-ピラン-4-イルエチル) アミノ] -3 , 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3- g] キノリン-3-オール塩酸塩

(収率 72%)

無色結晶

mp.: 318-320℃ (分解)

[0712]

合成例 5 5

(3R*, 4S*) - 7 - 9 - 1 - 2, 2, 9 - 1 - 1 + 1 - 2 - 1 - 2H-チオピラン-4-イルエチル) アミノ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3g] キノリン-3-オール

(収率 63 %)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 1.28 (s, 3H), 1.40-1.60 (m,5H), 1.56 (s, 1H), 1.90-2.00 (m, 2) H), 2.59 (s, 3H), 2.50-2.85 (m, 6H), 3.23 (s, 1H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.16(s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.91 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;421 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;465 [M+45]^{+}$

[0713]

合成例 5 6

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ4 - (+ [6 - (4 - クロロフェニル) - 3 - ピリジニル] メチル アミノ) -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3ーオール 塩酸塩

フリー体

(3R*, 4S*) - 7 - クロロ4 - (+ [6 - (4 - クロロフェニル) - 3 - ピリジニル] メキノリン-3-オール

(収率 16%)

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.30 (s, 3H), 1.59 (s, 3H),1.60 (br s, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.9 8 (s, 1H), 3.75-4.10 (m, 4H), 7.19 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.45 (d, J=8.8 Hz, 2H)), 7.71 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.80 (dd, J = 9.0, 2.2Hz, 1H), 7.96 (d, J = 8.8 Hz, 2) H), 8.09 (s, 1H), 8.66 (d, J = 2.2 Hz, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;494[M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;538 [M+45]^{+}$

[0714]

塩酸塩

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロ4 - ({[6-(4-クロロフェニル)-3-ピリジニル]メチル}アミノ) - 2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 塩酸塩$

(収率 67 %)

淡黄色固形物

[0715]

合成例 5 7

(3R*, 4S*) - 4 - [(2 - ベンゾフラニルメチル) アミノ] - 7 - クロロー 2, 2, 9 - トリメチルー 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 - オール (収率 74%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl3) δ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),2.0 (br), 2.59 (s, 3H), 3.35 (br, 1H), 3.75 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 4.04 (dd, J = 10.2, 1.1 Hz, 1H), 4.06 (s, 2H), 6. 60 (s, 1H), 7.16 (s, 1H),7.18-7.27 (m, 2H), 7.30 (s, 1H), 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 7.49-7.52 (m, 1H), 8.08 (d, J = 1.1 Hz, 1H)

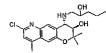
 $MS (ESI^{+}) m / z;423 [M+1]^{+}$

[0716]

合成例 5 8

(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - [(2-ヒドロキシペンチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール

【0717】 【化87】



[0718]

窒素気流下、 $(3R^*, 4S^*)$ -4-アミノー 7-クロロー2, 2, 9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2Hーピラノ [2, 3-g] キノリンー3ーオール(100 mg, 0.343mmol) と過塩素酸リチウム(36 mg, 0.343 mmol)のジオキサン溶液(0.50mL)に室温で 1, 2-エポキシペンタン(71 μ L, 0.682 mmol)を加え、70Cで 2 5 時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1 /1)で精製し、目的物(収率59 %)を得た。

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 0.93 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.28 (s, 3H), 1.30-1.50 (m, 4H), 1.5 7 (s, 3H), 1.91 (br s, 3H), 2.59 (s, 3H), 2.60-2.70 (m, 1H), 2.85-3.00 (m, 1H), 3.60-3.75 (m, 2H), 3.90-4.00 (m, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.99 (s, 0.5H), 8.00 (s, 0.5H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;379 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;423 [M+45]^{+}$

[0719]

合成例 5 9

(8R*, 9S*)-7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 1マレイン酸塩

【0720】

N COOH COOH COOH 7 2 1]

 $(3R^*, 4S^*)$ -6, 7 - 3 7 - 3 4 - 3 4 - 4

出証特2005-3008820

ルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール 【0722】

【化89】

H₂N Ph

[0723]

黒色無定形

¹H-NMR (CDC1₃) δ : 1.13 (s, 3H), 1.43 (s, 3H), 2.60-3.0 (m, 4H), 2.5-3.5 (br 6H), 3.47 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.51 (d, J= 9.6 Hz, 1H), 6.12 (s, 1H), 6.14 (s, 1H), 7.15-7.50 (m, 5H)

MS (ESI) m / z; $400[M+1]^+$, 327 (bp).

[0724]

(8R*, 9S*) - 7, 7 - ジメチル - 9 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] - 8, 9 - ジヒドロ - 7H - ピラノ[2, 3 - g] - キノキサリン - 8 - オール

【0725】 【化90】

HÃ OH

[0726]

(3R*, 4S*)-6, 7-ジアミノ-3, 4-ジヒドロ-2, $2-ジメチル-4-(2'-フェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール(1.5g, 4.58mmol)のエタノール溶液 <math>(30m\,L)$ に室温で40%グリオキサール水溶液(997mg, 6.87mmol) を加え、室温で30分攪拌した. 反応終了後、酢酸エチルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した. 得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物(収率74%)を得た.

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 1.26 (s, 3H), 1.56 (s, 3H),1.60 (br s, 1H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 2.90–3.10 (m, 3H), 3.62 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 3.90 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 7.24–7.40 (m, 5H), 7.42 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.05 (d, J= 1.7 Hz, 1H), 8.72 (d, J= 1.7 Hz, 1H)

MS (ESI⁺) m / z;350 [M+1]⁺

 $MS (ESI^{-}) m / z;349 [M-1]^{+}$

[0727]

(8R*, 9S*)-7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 1マレイン酸塩 (8R*, 9S*)-7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール(1.18g, 3.38 mmol)の酢酸エチル溶液 (22 mL) に室温でマレイン酸 (471mg, 4.06mmol) を加え10分攪拌した.反応終了後、固形物を濾取し、酢酸エチルで洗浄、乾燥し、目的物(61% 収率)を得た.淡灰色結晶

mp.: 176-179℃(分解)

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ : 1.20 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 2.90-3.70 (m, 6H), 4.00-4.15 (m, 1H), 4.71 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 6.07 (s, 2H), 6.34 (br s, 1H), 7.15-7.45 (m, 5H), 7.43 (s, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.88 (s, 1H).

[0728]

合成例 6 0

```
-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
  [0729]
   【化91】
  [0730]
 合成例60は合成例59と同様の方法により合成した。
  [0731]
(3R*, 4S*)-6, 7-ジアミノ-3, 4-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-4-(2 '- (2-1))
フルオロフェニル) エチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール
  [0732]
   【化92】
  [0733]
 (収率 87 %)
黒色無定形物
MS (ESI^{+}) m / z;346 [M+1]^{+}
MS (ESI^{-}) m / z;380 [M+45]^{+}
  [0734]
-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-<math>8-オール
  [0735]
    【化93】
  [0736]
 (収率 25 %)
灰色無定形物
^{1}\text{H-NMR} (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.26 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.74 (br s, 2H), 2.85-3.15 (m, 4H)
, 3.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.91 (d, J =10.4 Hz, 1H), 7.00-7.15 (m, 3H), 7.15-7
.35 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.66 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 1
.7 Hz. 1H).
MS (ESI^{+}) m / z;368 [M+1]^{+}
MS (ESI^{-}) m / z;412 [M+45]^{+}
   [0737]
 (8 R*, 9S*) - \{[2-(2-7)\nu + 7] + 7\nu\} - 7, 7-5 + 7\nu
 -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール塩酸塩
 (収率 95%)
 無色結晶
 mp.: 265-268℃(分解)
 合成例 6 1
 (8 R*, 9S*) - \{[2-(4-7) + 7) + 7\} - 7, 7-9 + 7
 -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
   [0738]
```

```
【化94】
       [0739]
    合成例61は合成例59と同様の方法により合成した。
       [0740]
(3R^*, 4S^*) - 6, 7 - \Im F \ge J - 3, 4 - \Im F F D - 2, 2 - \Im F F D - 4 - (2 '- (4 - 2))
フルオロフェニル)エチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール
       [0741]
             【化95】
       [0742]
  (収率 87 %)
黒色無定形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.13 (s, 3H), 1.45 (s, 3H),1.90 (br s, 4H), 2.75-3.00 (m, 6H)
, 3.50-3.70 (m, 2H), 6.16 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 7.02 (t, J=8.5 Hz, 2H), 7.17 (
t, J = 8.5 Hz, 2H).
        [0743]
-8, 9-3ビドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール
        [0744]
             【化96】
       [0745]
   (収率 23 %)
桃色油状物
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) \delta: 1.27 (s, 3H), 1.57 (s, 3H), 1.69 (br s, 2H), 2.83 (t, J = 6.9)
Hz, 2H), 2.90-3.10 (m, 4H), 3.64 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 10.4 Hz, 1H),
  6.95-7.05 (m, 2H), 7.15-7.25 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.66 (d, J=1
.7 \text{ Hz}, 1\text{H}), 8.73 \text{ (d, } J=1.7 \text{ Hz}, 1\text{H}).
       [0746]
(8R*, 9S*) - \{[2-(4-7)\pi 7] + (2\pi) \pi^2 7 + (3R*) \pi^2 7 + 
-8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
  (収率 95 %)
茶色結晶
mp.: 191-197℃ (分解)
       [0747]
合成例 6 2
(8R*, 9S*) - 9 - [(2 - EFD + v - 2 - DED + v) P = J] - 7, 7 - V
メチルー8, 9- ジヒドロー7H- ピラノ[2, 3-g]-キノキサリンー8-オール
        [0748]
             【化97】
```

[0749]合成例62は合成例59と同様の方法により合成した。 [0750] $(3R*, 4S*) - 6, 7 - \Im r \ge J - 3, 4 - \Im \iota \iota \iota \iota \iota \iota - 2, 2 - \Im \iota \iota \iota \iota + \mu - 4 - (2 '-r) \ge 1$ ノー1'ーフェニルエチルー1ーヒドロキシ)ー2H-1-ベンゾピランー3-オール [0751]【化98】 [0752](収率 92%) 分離不能2種ジアステレオマー 黒色無定形物 ¹H-NMR (CDCl₃) δ : 1.16 (s, 3H), 1.43 (s, 3H), 2.31 (br s, 7H), 2.70-3.05 (m, 3H) , 3.50-3.70 (m, 2H), 4.70-4.80 (m, 1H), 6.16(s, 1H), 6.53 (s, 0.5H), 6.58 (s, 0. 5H), 7.20-7.40 (s. 5H). メチルー8、9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー8-オール (収率 66%) [0753]分離不能2種ジアステレオマー 灰色無定形物 ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 1.30 (s, 3H), 1.58 (s,1.5H), 1.59 (s, 1.5H), 1.70 (br s, 3H), 2.90-3.10 (m, 2H), 3.71 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.95-4.05 (m, 1H), 7.20-7.45 (m, 6H) , 8.10 (s, 0.5H), 8.12 (s, 0.5H), 8.64 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.73 (d, J = 1.9 Hz, 1H). $MS (ESI^{+}) m / z;366 [M+1]^{+}$ $MS (ESI^{-}) m / z;410 [M+45]^{+}$ [0754]合成例 6 3 $(8R*, 9S*) - 7, 7 - \underbrace{\text{5l}} + 9 - (\text{cl} + \text{l} -ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩 [0755] 【化99】 He1 [0756]合成例63は合成例59と同様の方法により合成した。 [0757]ノー2H-1ーベンゾピランー3ーオール [0758] 【化100】 [0759] (収率 98%) 茶色無定形物

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 0.80-0.90 (m, 3H), 0.99 (s,3H), 1.26 (s, 3H), 1.30-1.50 (m, 5

出証特2005-3008820

```
H), 2.20-2.30 (m, 1H), 2.40-2.50 (m, 4H), 3.30-3.60 (m, 4H), 3.90 (br s, 2H), 4.3
4 (br s, 2H), 4.93 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 5.89 (s, 1H), 6.59 (s, 1H).
      [0760]
-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8ーオール
     [0761]
          【化101】
   нй∕
      [0762]
(収率 36%)
橙色無定形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 0.90 (t, J =7.4 Hz, 3H), 1.32 (s, 3H), 1.20-1.40 (m, 3H), 1.60
-1.70 (m, 3H), 1.61 (s, 3H), 1.81 (brs, 2H), 2.60-2.90 (m, 2H), 3.68 (d, J = 10.
2Hz, 1H), 3.93 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.66 (d, J = 1.9
 Hz, 1H), 8.74(d, J = 1.9 Hz, 1H).
      [0763]
-ピラノ[2,3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
(収率 96%)
淡黄色結晶
mp.: 209-212℃ (分解)
MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;316 [M+1]<sup>+</sup>
      [0764]
合成例 6 4
]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
      [0765]
          【化102】
      [0766]
    合成例64は合成例59と同様の方法により合成した。
      [0767]
]-8, 9-iiiin - 7H-iin - 7H-iin - 2, 3-g]-iin - 3+iin       [0768]
          【化103】
     HŅ∕∽Ph
      [0769]
  (収率 80%)
 白色無定形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.24 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 2.68 (s, 6H), 2.84 (t, J = 6.9 Hz,
  2H), 2.90-3.10 (m, 4H), 3.59 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 7.
20-7.40 (m, 6H), 7.82 (s, 1H).
MS (ESI^{+}) m / z;378 [M+1]^{+}
MS (ESI<sup>-</sup>) m / z;380 [M+45]<sup>+</sup>
      [0770]
合成例 6 5
```

(8 R*, 9S*)-2,3,-ジエチル-7, 7-ジメチル 9-[(2-フェニルエチル) アミノ]ー8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリンー8ーオール[0771]

【化104】



[0772]

合成例65は合成例59と同様の方法により合成した。

(収率 79%)

白色固形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.23 (s, 3H), 1.39 (q, J =6.6 Hz, 6H), 1.54 (s, 3H), 2.80-2.9 0 (m, 2H), 2.95-3.10 (m, 10H), 3.60 (d, J =10.4 Hz, 1H), 3.85 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m,6H), 7.81 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;406 [M+1]^{+}$

[0773]

合成例 6 6

ル) アミノ] -8 , 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン<math>-8-オール[0774]

【化105】



[0775]

合成例66は合成例59と同様の方法により合成した。

(収率 33%、低極性成分)

白色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.27 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.66 (br s. 2H), 2.72 (s, 3H), 2.8 3 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.90-3.15 (m, 4H), 3.61 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.88 (d, J = 10.2 Hz) $10.2~\mathrm{Hz},~1\mathrm{H}), 7.15-7.35~(\mathrm{m},~5\mathrm{H}),~7.36~(\mathrm{s},~1\mathrm{H}),~7.50-7.60~(\mathrm{m},~3\mathrm{H}),~7.60-7.70~(\mathrm{m},~2\mathrm{Hz}),~2.50-7.60~(\mathrm{m},~2\mathrm{Hz}),~2.50-7.80~(\mathrm{m},~2\mathrm{Hz}),~2.50$ 2H), 7.97 (s,1H).

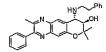
MS (ESI⁺) m / z;440 [M+1]⁺

[0776]

合成例 6 7

(u) アミノ] (u) 9 (u) 9 (u) 7 (u) 7 (u) 7 (u) 7 (u) 7 (u) 9 (u) 7 (u) 9 (u) 7 (u) 9 (u) 7 (u) 9 [0777]

【化106】



[0778]

合成例67は合成例59と同様の方法により合成した。

(収率 29 %、高極性成分)

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.95-3.12 (m, 4H), 3.62 (d, J=10.2 Hz, 1H), 3.91 (d, J=10.2 Hz, 1H), 7.8420-7.35 (m, 5H), 7.42 (s, 1H), 7.45-7.55 (m, 3H), 7.60-7.70 (m, 2H), 7.90 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;440 [M+1]^{+}$

[0779]

合成例 6 8

```
(8R*, 9S*)-2,3,-ジェチャー7, 7-ジメチャ 9-[(2-フェニルエチャ)) ア
[2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2,
           [0771]
                  【化104】
              HŅ∕~Ph
           [0772]
       合成例65は合成例59と同様の方法により合成した。
    (収率 79%)
白色固形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.23 (s, 3H), 1.39 (q, J =6.6 Hz, 6H), 1.54 (s, 3H), 2.80-2.9
0 \text{ (m, } 2\text{H), } 2.95-3.10 \text{ (m, } 10\text{H), } 3.60 \text{ (d, } J = 10.4 \text{ Hz, } 1\text{H), } 3.85 \text{ (d, } J = 10.4 \text{ Hz, } 1\text{Hz, } 1\text{Hz
H), 7.20-7.40 (m, 6H), 7.81 (s, 1H).
MS (ESI^{+}) m / z;406 [M+1]^{+}
           [0773]
合成例 6 6
(8R*, 9S*) - 3, 7, 7 - h y + y - 2 - y - 2 - y - 9 - [(2 - y - 2 - y - 2 - y - 4) - 3]
 ル) アミノ] -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール
            [0774]
                   【化105】
            [0775]
        合成例66は合成例59と同様の方法により合成した。
     (収率 33%、低極性成分)
  白色無定形物
 ^{1}H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) \delta: 1.27 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.66 (br s. 2H), 2.72 (s, 3H), 2.8
 3 (t, J = 6.9 \text{ Hz}, 2\text{H}), 2.90-3.15 (m, 4\text{H}), 3.61 (d, J = 10.2 \text{ Hz}, 1\text{H}), 3.88 (d, J = 10.2 \text{ Hz}, 1\text{H})
   10.2 Hz, 1H), 7.15-7.35 (m, 5H), 7.36 (s, 1H), 7.50-7.60 (m, 3H), 7.60-7.70 (m,
 2H), 7.97 (s,1H).
 MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;440 [M+1]^+
            [0776]
 合成例 6 7
 ル) アミノ] -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g] -キノキサリン-8-オール
            [0777]
                    【化106】
             [0778]
         合成例67は合成例59と同様の方法により合成した。
      (収率 29 %、高極性成分)
  ^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz,
     2H), 2.95-3.12 (m, 4H), 3.62 (d, J=10.2 Hz, 1H), 3.91 (d, J=10.2 Hz, 1H), 7.
  20-7.35 (m, 5H), 7.42 (s, 1H), 7.45-7.55 (m, 3H), 7.60-7.70 (m, 2H), 7.90 (s, 1H)
 MS (ESI^{+}) m / z;440 [M+1]^{+}
             [0779]
```

合成例 6 8

特願2004-084605 $(8R^*, 9S^*) - 3, 7, 7 - hy + hu - 9 - [(2 - y + hu + hu) r + y] - 8$, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール1マレイン酸塩 [0780] 【化107】 OH COOH [0781] 合成例68は合成例59と同様の方法により合成した。 [0782] (8R*, 9S*) - 3, 7, 7 - hy + y + y - 9 - [(2 - y + z + y) r + y] - 8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール [0783] 【化108】 $_{\text{H}\underline{\text{N}}} \diagdown^{\text{Ph}}$

[0784]

(収率 52%)

白色無定形物

 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.25 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.84 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.90-3.10 (m, 4H), 3.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.8015-7.40 (m, 6H), 7.89 (s, 1H), 8.54 (s, 1H).

[0785]

 $(3R^*, 4S^*) - 7 - x + y - 4 - 4 - (2)$ (-)フェニルエチルアミノ)-2H-1ーベンゾピラン-3ーオール 1マレイン酸塩

無色結晶

mp.: 189-192℃ (分解)

[0786]

合成例 6 9

8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー8-オール 塩酸塩

[0787]

【化109】



[0789]【化110】



[0790]

(3R*, 4S*)-6, 7ージアミノー3, 4ージヒドロー2, 2ージメチルー4ーアミノー2 H-1-ベンゾピラン-3-オール (280mg, 1.25 mmol)のエタノール溶液 (5.6 mL) に室 温で40%グリオキサール水溶液 (226mg, 1.56 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した. 反応 終了後、1mol/L塩酸を加え、酢酸エチルで洗浄、水相を1mol/L水酸化ナトリウム水溶液で pH 14にし、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した . 得られた混合物をシリカゲルカラム(酢酸エチル/メタノール=10/1)で精製し、目 的物(収率35%)を得た。

淡茶色無定形物

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.26 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 2.17 (br s, 3H), 3.49 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 7.41 (s,1H), 8.13 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.72 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z:246 [M+1]^{+}$

[0791]

(8R*, 9S*) - 9 - アミノ - 7, 7 - ジメチル - 8, 9 - ジヒドロ - 7H - ピラノ[2, 3 - g] - キノキサリン - 8 - オール

[0792]

【化111】



[0793]

(8R*, 9S*) - 9-アミノ - 7 - 7 - 5

黄色油状物

¹ H-NMR (CDC1₃) δ : 0.80-1.00 (m, 2H), 1.10-1.40(m, 4H), 1.31 (s, 3H), 1.44 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 1.60 (s, 3H), 1.65-1.80(m, 6H), 2.65-2.90 (m, 2H), 3.68 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.93 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.67 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.73 (d, J = 1.9 Hz, 1H).

[0794]

(8 R*, 9S*) - 9 - アミノ - 7, 7 - ジメチル - 8, 9 - ジヒドロ - 7 H - ピラノ[2, 3 - g] - キノキサリン - 8 - オール 塩酸塩

(収率 89%)

黄色結晶

mp.: 258-259℃ (分解)

 $MS (ESI^{+}) m / z;356 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z;400[M+45]^{+}$

[0795]

合成例70

6, 7-イミダゾリノー3, 4-ジヒドロー2, 2-ジメチルー4-(2 '-フェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピランー3-オール

[0796]

【化112】



[0797]

6,7-ジアミノ-3,4-ジヒドロ-2,2-ジメチル-4-(2 'ーフェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール(500mg,1.53mmol)のジオキサン溶液(7ml)に4mol/L塩酸/ジオキサン溶液(0.38ml)を加え、室温で15分攪拌した。続いて、クロロギ酸フェニル(0.21ml,1.53mmol)、トリエチルアミン(0.21ml,1.53mmol)を加え、室温で1時間攪拌した。さらに、トリエチルアミン(0.63ml,4.58mmol)を加え、室温で2時間攪拌した。反応終了後、1mol/L塩酸を加えて、pHerovarder 7~8に調製した後、酢酸エチルで抽出、飽和食塩

水で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(メタノール/クロロホルム=1/20)で精製し、目的物(収率 4%)を得た.

黄色無定形物

 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.15 (s, 3H), 1.30-1.41 (br,1H), 1.45 (s, 3H), 2.71-3.96 (m, 4H), 3.51 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.51 (s, 1H), 7.12-7.48 (m, 7H), 7.76 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;354 [M+1]^{+}$

[0798]

合成例 7 1

(7R*, 8S*) - 7 - ヒドロキシ-6, 6 - ジメチル-8 - (2 - フェニルエチルアミノ) - 4, 6, 7, 8 - テトラヒドロー1, 5 - ジオキサー4 - アザーアントラセンー3 - オン

【0799】 【化113】



[0800]

4- (1, 1-ジメチル-2-プロペニルオキシ) アニソール

[0801]

【化114】



[0802]

4-メトキシフェノール(15.0 g, 121 mmol)のアセトニトリル(75 mL)溶液に氷冷下、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]ウンデセン(23.9 g,157 mmol)を加え0℃で30分攪拌した(溶液1)。2-メチルー3-ブテンー2-オール(11.7 g,139 mmol)のアセトニトリル(75 mL)溶液に氷冷下、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]ウンデセン(23.9g,157 mmol)を加え0℃で30分攪拌し、続いて、無水トリフルオロ酢酸(25.4 g,121 mmol)を加え、0℃で30分攪拌した(溶液2)。溶液1に塩化第一銅(36 mg,0.36 mmol)を加え、続いて溶液2を15分かけて滴下した。滴下終了後室温に昇温し、終夜攪拌した。反応終了後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、溶媒を減圧留去した。残渣に1mol/L塩酸水溶液を加えて、酢酸エチルで抽出、有機相を1mol/L塩酸水溶液で1回、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で2回、飽和食塩水で1回洗浄した。有機相を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去して、そのまま次の反応に用いた。

[0803]

6-メトキシ-2, 2-ジメチル-2H-1-ベンゾピラン

[0804]

【化115】



[0805]

4- (1, 1-ジメチルー2ープロペニルオキシ) アニソールの1, 2-ジクロロベンゼン (50 mL) 溶液を190 $\mathbb C$ で2時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/クロロホルム= 3/1) で精製し、目的物を赤色油状物として得た(2工程、収率61%)。

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.41 (s, 6H), 3.75 (s, 3H),5.64 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.28 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.55 (d, J= 2.7 Hz, 1H), 6.64-6.73 (m, 2H)

 $MS (ESI^{+}): 191[M^{+}+1]$

[0806]

6-メトキシ-2, 2-ジメチル-7-ニトロ-2H-1-ベンゾピラン 【0807】 【化116】

MeO CON

[0808]

6-メトキシ-2, 2-ジメチル-2H-1-ベンゾピラン(3.1 g, 16.4 mmol)の酢酸(6.2 mL)及び無水酢酸(6.2 mL)の混合溶液を氷冷し、硝酸(1.37mL,18.0 mmol)を滴下した後、0Cで1時間攪拌した。反応終了後、反応液に1mol/L水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチル(150 mL)で抽出した。有機相を1mol/L水酸化ナトリウム水溶液で2回、飽和食塩水で1回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(∞ キサン/酢酸エチル=6/1)で精製し、目的物を黄色結晶として得た(収率79%)。

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.44 (s, 6H), 3.91 (s, 3H),5.85 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 6.33 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 6.69 (s, 1H),7.34 (s, 1H)

 $MS (ESI^+): 236 [M^++1]$

[0809]

【0810】 【化117】



[0811]

6ーメトキシー2, 2ージメチルー7ーニトロー2Hー1ーベンゾピラン(10.0g, 42.5 mmol)のアセトニトリル溶液(300mL)に、室温でN–メチルイミダゾール(0.678mL, 8.50 mmol)、(R,R,S,S)–(Ph,Ph)–香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、(R,R,S,S)–(Ph,Ph)–香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、(R,R,S,S)–(Ph,Ph)–香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、(R,R,S,S)–(Ph,Ph)–香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、(R,R,S,S)–(Ph,Ph)–香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、(R,R,S,S)–(Ph,Ph)–香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、(R,R,S,S)–(Ph,Ph)–香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S,S)–(R,R,S)

MS (ESI): 251 [M⁺]

HPLC:18.6 min (エナンチオマー 24.1min)

HPLC条件: chiralcel OJ-RH, MeCN/MeOH/0.01 M NaClaq. = 1/3/5, 1.0 ml/min, 40℃, 2 56 nm

[0812]

【0813】 【化118】



[0814]

 $(3R^*, 4R^*)$ -3, 4 - x + y -6 - y + y -2, 2 - y y y y y -7 - x

水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機相を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残査をカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=6/4)で精製し、目的物を橙色アモルファス状物として得た(定量的)。

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.15 (s, 3H), 1.47 (s, 3H),2.73-2.95 (m, 4H), 3.60 (d, J = 10 .0 Hz, 1H), 3.68 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 6.78 (s, 1H), 7.21-7.35 (m, 6H)

MS (ESI): 372[M⁺]

[0815]

【0816】 【化119】



[0817]

MS (ESI): $473 [M^+ + 1]$

[0818]

t-ブチル (3R*, 4S*) -7-アミノー3-ヒドロキシー6-メトキシー2, 2ージメチルー3、<math>4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピランー4-イル(2-フェニルエチル)カルバメート

【0819】 【化120】



[0820]

t-ブチル (3R*, 4S*) -3-ヒドロキシ-6-メトキシ-2, 2-ジメチル-7-ニトロ-3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-4-イル (2-フェニルエチル) カルバメート (1.32g, 2.80 mmol) と5%パラジウム-炭素 (132mg)のメタノール (26mL) 溶液を、水素雰囲気下室温で終夜攪拌した。反応終了後、反応液をセライトろ過し、溶媒を留去後、残査をカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル= 4 / 1) で精製し、目的物を得た(収率94%)。

無色固形物

MS (ESI $^+$): 443[M $^+$ +1]

[0821]

[0822]

【化121】

[0823]

(3R*, 4S*) -7-アミノー3-ヒドロキシー6-メトキシー2, 2-ジメ tーブチル チルー3、4ージヒドロー2H-1-ベンゾピランー4ーイル(2ーフェニルエチル)カルバメ ート(270mg, 0.61 mmo1)のテトラヒドロフラン溶液に室温で、トリエチルアミン(128 μ L 0.92 mmol)、クロロアセチルクロリド(73μL, 0.92 mmol)を加え、室温で2時間半攪 拌した。反応終了後、エタノール1mL、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチル で抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリ カゲルカラム (ヘキサン/酢酸エチル=5/1) で精製し目的物を得た。 (91%収率) 無色油状物

[0824]

2-クロロ-N-[(3 R^* , $4S^*$)-3, 6-ジヒドロキシ-2, 2-ジメチル-4-(2-フェニルエチルアミノ) -3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-7-イル]-アセト アミド

[0825] 【化122】

[0826]

キシー6-メトキシー2,2-ジメチルー3、4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピランー4-イ ル] (2-フェニルエチル) -カルバメート(251 mg, 0.48mmol) の塩化メチレン溶液(5m L) に0℃で3臭化ボラン (1 M塩化メチレン溶液、2.42mL, 2.42 mmol) を加え、2時間 攪拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、 飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカ ラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で精製し目的物を得た。(70%収率)

淡桃色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.33 (s, 3H),1.44 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.50 (d, J = 9. 6 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.23 (s, 2H), 6.58 (s, 1H), 6.83 (s, 1H), 7.6820-7.35 (m, 5H), 8.47 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 405 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z: 403 [M-1]^{+}$

[0827]

-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサ-4-アザーアントラセン-3-オ ン

[0828] 【化123】

[0829]

2-クロローNー[(3R*, 4S*)ー3, 6-ジヒドロキシー2, 2-ジメチルー4-(2-フェニルエチルアミノ)-3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-7-イル]-アセ トアミド (120 mg,0.30 mmol) のメタノール溶液 (1.2mL) に室温で1mol/L水酸化ナトリ ウム水溶液(1.5mL)を加え、4時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液 を加え、酢酸エチルで抽出、1mo1/L水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マ グネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチ ル=1/1)で精製し目的物を得た。(72%収率)

無色固形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) $\delta:1.14$ (s, 3H),1.44 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.47 (d, J = 9.9) Hz, 1H), 3.56 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.50 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 4.55 (d, J = 15.4Hz, 1H), 6.27 (s, 1H), 6.68(s, 1H), 7.20-7.35 (m, 5H), 7.74 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 369 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z: 367 [M-1]^{+}$

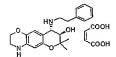
[0830]

合成例 7 2

, 7, 8-ヘキサヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー7-オール マ レイン酸塩

[0831]

【化124】



[0832]

)-4,6,7,8-テトラヒドロー1,5-ジオキサー4-アザーアントラセンー3-オン(42 mg, 0.11 mmol) のテトラヒドロフラン溶液(1.2mL) に室温で水素化リチウムア ルミニウム(1Mテトラヒドロフラン溶液、570µL, 0.57 mmol)を加え、90℃で1.5時間攪 拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食 塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物の酢酸エチル溶液 (60 $0\,\mu\,\mathrm{L}$)に室温で、マレイン酸($13\mathrm{mg}$, $0.11\mathrm{mmol}$)、ヘキサン $(1\mathrm{mL})$ を加え、室温で15分間攪 拌した。得られた結晶を濾取し、目的物を得た。(60%収率)

淡茶色固形物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (DMSO-d₆) δ : 1.04 (s, 3H),1.36 (s, 3H), 2.85-3.30 (m, 6H), 3.80-3.85 (m, 1H), 4.11 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 4.15-4.20 (m, 1H), 6.05 (s, 2H), 6.18 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).

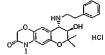
[0833]

合成例 7 3

(7R*, 8S*) - 7 - ヒドロキシー4, 6, 6 - トリメチル<math>-8 - (2 - 7 x = 7 x + 7ミノ)-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサ-4-アザーアントラセンー 3ーオン 塩酸塩

[0834]

【化125】



[0835]

t-ブチル (7R*, 8S*) - [7-ヒドロキシー6, 6-ジメチルー3ーオキソー2, 3, 4, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロー1, 5 - ジオキサー4 - アザーアントラセンー8 -イル](2-フェニルエチル)-カルバメート

[0836]

【化126】

)-4 , 6 , 7 , 8-テトラヒドロー1 , 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー3-オン(150 mg, 0.41 mmol) のテトラヒドロフラン溶液 (3 mL) に室温でトリエチルアミン (85 µ L, 0.61 mmol) 、炭酸ジt-ブチル(178 mg, 0.81 mmol)を加え、90℃で1.5時間攪 拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩 水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(へ キサン/酢酸エチル=3/1)で精製し目的物を得た。(85%収率)

 $MS (ESI^{+})m / z: 469 [M+1]^{+}$

MS (ESI⁻) m / z: 467 $[M-1]^+$

[0838]

tーブチル (7R*, 8S*) - [7-ヒドロキシ-4, 6, 6-トリメチルー3ーオキソー2, 3, 4, 6, 7, 8-ヘキサヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセ ン-8-イル](2-フェニルエチル)ーカルバメート

[0839] 【化127】

[0840]

t -ブチル (7 R*, 8S*) - [7 - ヒドロキシー 6, 6 - ジメチルー 3 - オキソー2, 3, 4, 6, 7, 8-ヘキサヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー 8-イル](2-フェニルエチル) -カルバメート(106 mg, 0.23 mmol) のジメチルホルムアミド溶液(2 mL)に室温で炭酸カリウム(79mg, 0.57 mmol)、ヨウ化メチル(28 μ L, 0.46 mmol) を加え、室温で4時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を 加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得ら れた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル= 2 / 1)で精製し目的物を得た 。(100%収率)

 $MS (ESI^{+})m / z: 505 [M+23]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z: 527 [M+45]^{+}$

[0841]

(7R*, 8S*) - 7 - ヒドロキシー 4, 6, 6 - トリメチルー8 - (2 - フェニルエチルアミノ)ー4,6,7,8ーテトラヒドロー1,5-ジオキサー4-アザーアントラセンー 3ーオン

[0842]【化128】

[0843]

tーブチル (7R*, 8S*)ー[7-ヒドロキシー4, 6, 6ートリメチルー<math>3ーオ キソー2, 3, 4, 6, 7, 8ーヘキサヒドロー1, 5ージオキサー4ーアザーアントラ センー8ーイル] (2-フェニルエチル) ーカルバメート(115 mg, 0.24 mmol) のエーテ ル溶液 (2.2 mL) に室温で4mo1/L塩化水素-ジオキサン(500 μ L)を加え、室温で5時間 、50℃で30分間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチ ルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシ リカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で精製し目的物を得た。(76%収率) 無色油状物

 1 H-NMR (CDCl₃) δ : 1.17 (s, 3H),1.47 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.29 (s, 3H), 3.49 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.58(d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.52 (d, J = 15.1 Hz, 1H), 4.58 (d, J = 15.1 Hz, 1H), 6.42(s, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.20-7.35 (m, 5H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 383 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z: 427 [M+45]^{+}$

[0844]

淡桃色固形物

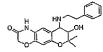
[0845]

合成例 7 4

7-ヒドロキシー6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-7, 8-ジヒドロ-1 H, 6 H-4, 5-ジオキサ-1-アザーアントラセン-2-オン

[0846]

【化129】



[0847]

4-(1, 1-i)メチルー 2-iロピニルオキシ) -2-iメトキシメトキシー 1-iトローベンゼン

[0848]

【化130】



[0849]

2-ニトロ-4-フルオロフェノール(1.6g, 10.2 nmol) のテトラヒドロフラン溶液(32 nL)に室温でクロロメチルメチルエーテル(1.23g, 15.3 nmol)、ジイソプロピルエチルアミン(2.66nL, 15.3 nmol)を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物のジメチルアセトアミド溶液(17 nL)に0^{\mathbb{C}}で水素化ナトリウム(553ng, 12.3 nmol)、1-メチル-2-ブチン-1-オール(1.23nL, 12.7nmol)を加え、7時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(-2+サン/酢酸エチル-5/1)で精製し目的物を得た。(-94%収率) 黄色油状物

[0850]

7-メトキシメトキシー2, 2-ジメチルー6-ニトロー2H-1-ベンゾピラン

[0851]

【化131】



[0852]

4-(1,1-i)メチルー2ープロピニルオキシ)ー2ーメトキシメトキシー1ーニトローベンゼン(2.1~g,7.92mmol)のジクロロベンゼン溶液(21~mL)を200℃で0.5時間攪拌した。反応終了後、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=5/1)で精製し、目的物とその位置異性体の混合物(1:1)を得た。(77%収率)

黄色油状物

¹H-NMR (CDCl₃) δ : 1.46 (s, 6H), 3.53 (s, 1.5 H), 3.58 (s, 1.5H), 5.10 (s, 1H), 5.27 (s, 1H), 5.64 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 5.74 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 6.60-6.70 (m, 1.5H), 7.67 (s, 0.5H), 7.77 (d, J = 9.1 Hz, 0.5H).

[0853]

3- $\overline{)}$ \overline

[0854]

【化132】



[0855]

7-メトキシメトキシー 2 , 2-ジメチルー 6-ニトロー 2 H-1-ベンゾピランとその位置異性体の混合物 $(1.5\,$ g, $5.65\,$ mmol) のジメチルスルホキシドー水溶液($17\,$ mL)に室温でN-プロモサクシンイミド $(1.21g, 6.78\,$ mml) を加え3時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム((27%収率)
黄色固形物

 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.45 (s, 3H), 1.63 (s, 3H), 2.73 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.52 (s, 3H), 4.08 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 4.88 (dd, J = 9.4, 4.4 Hz, 1H), 6.71 (s, 1H), 8.1 6 (s, 1H).

[0856]

3, 4-エポキシ-7-メトキシメトキシ-2, 2-ジメチル-6-ニトロ-3, 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン

[0857]

【化133】



[0858]

3-プロモー7-メトキシメトキシ 2, 2-ジメチルー6-ニトロー1-ベンゾピランー4-オール(550 mg, 1.52 mmol)のジオキサン溶液(5.5m L)に室温で1mol/L水酸化ナトリウム水溶液(1.82mL,1.82 mmol)を加え、2時間攪拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し目的物を得た。(78%収率)

黄色油状物

¹H-NMR (CDCl₃) δ : 1.32 (s, 3H), 1.59 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.52 (d. J = 3.9 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 6.73 (s, 1H), 8.05 (s, 1H).

[0859]

7-メトキシメトキシー 2 , 2-ジメチルー 6-ニトロー 4- (2-フェニルエチルアミノ) -3 , 4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピラン

[0860]

【化134】

[0861]

3, 4-xポキシー7-xトキシメトキシー2, 2-ジメチルー6-ニトロー3, 4-ジヒドロー2Hー1-ベンゾピラン(332mg, 1.18 mmol)のジオキサン溶液(1.3 mL)に室温で過塩素酸リチウム(126mg, 1.18 mmol)、フェニルエチルアミン(214mg, 1.77 mmol)を加え、2時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し目的物を得た。(73%収率)淡黄色油状物

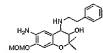
 1 H-NMR (CDC1₃) δ : 1.19 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.45-3.55 (m, 2 H), 3.50 (s, 3H), 5.24 (s, 2H), 6.66 (s, 1H), 7.15-7.40 (m, 5H), 7.72 (s, 1H).

[0862]

7- メトキシメトキシー 2 , 2- ジメチルー 6- アミノー 4- (2- フェニルエチルアミノ) -3 , 4- ジヒドロ- 2H- 1- ベンゾピラン

[0863]

【化135】



[0864]

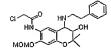
7-メトキシメトキシー 2 , 2-ジメチルー 6-ニトロー 4- (2-フェニルエチルアミノ) -3 , 4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピラン (265mg , 0.66mmol) のエタノール溶液 (5mL) に室温で5% パラジウムーカーボン (AER type, 13mg) を加え、水素気流下で一晩攪拌した。反応終了後、セライト濾過、濃縮し目的物を得た。(98%収率) 茶色油状物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.13 (s, 3H),1.43 (s, 3H), 2.70–3.05 (m, 8H), 3.51 (s, 3H), 3.52–3.60 (m, 2H), 5.12 (s, 2H),6.21 (s, 1H), 6.51 (s, 1H), 7.20–7.50 (m, 5H).

[0865]

[0866]

【化136】



[0867]

7-メトキシメトキシー 2 , 2-ジメチルー 6-アミノー 4- (2-フェニルエチルアミノ) -3 , 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン (242mg , 0.65 mmol) の酢酸エチルージメチルホルムアミド混合溶液 (5 m L) に0 $\mathbb C$ で4M塩化水素 -ジオキサン溶液 (194 μ L 、0.78 mmol) を加え5分間攪拌した。クロロアセチルクロリド (88 mg , 0.78 mmol) を加え、15分間攪拌した。反応終了後、エタノール、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム (∞ +サン/酢酸エチル=1/1) で精製し目的物を得た。(∞ 79%収率)

淡桃色油状物

¹H-NMR (CDCl₃) る: 1.17 (s, 3H), 1.45 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.43 (d, J = 9. 出証特 2 0 0 5 - 3 0 0 8 8 2 0

9 Hz, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.59 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.20 (s, 2H), 5.19 (s, 2H), 6.61 (s, 1H), 7.15-7.30 (m, 5H), 8.14 (s, 1H), 8.73 (s, 1H).

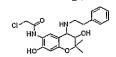
 $MS (ESI^{+}) m / z: 449 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^{-}) m / z: 447 [M-1]^{+}$

[0868]

2-クロロ-N-[3, 7-ジヒドロキシ-2, 2-ジメチル-4-(2-フェニルエチルアミノ)-3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-6-4-1-アセトアミド

【0869】 【化137】



[0870]

2- 2- 2- 2- 3- 2- 3- 2- 3-

 $MS^{-}(ESI^{+})m / z: 405 [M+1]^{+}$

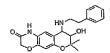
 $MS (ESI^{-}) m / z: 403 [M-1]^{+}$

[0871]

7ーヒドロキシー 6, 6-ジメチルー8ー(2-フェニルエチルアミノ)ー 7, 8-ジヒドロー1 H, 6 H - 4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー2-オン

[0872]

【化138】



[0873]

2-クロローN-[3, 7-ジヒドロキシー2, 2-ジメチルー4-(2-フェニルエチルアミノ) -3、4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピランー6-1ル]ーアセトアミド(187 mg, 0.46 mmol) のメタノール溶液(2mL) に室温で1mol/L水酸化ナトリウム水溶液(1.8mL)を加え、3時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、1mol/L水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(12、 で精製し目的物を得た。(13、 13 で精製し目的物を得た。(14 13 13 で精製し

無色油状物

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDC1₃) δ : 1.14 (s, 3H),1.45 (s, 3H), 2.65-3.00 (m, 4H), 3.53 (d. J = 9.9 Hz, 1H), 3.57 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.50 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 4.56 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 5.99 (s, 1H), 6.40(s, 1H), 7.15-7.40 (m, 5H).

MS (ESI^+) m / z: 369 $[M+1]^+$

[0874]

合成例 75 6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-2, 3, 7, 8-テトラヒドロー1H, 6H-4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー<math>7-オール マレイン酸塩

[0875]

【化139】

HN OH COOH

[0876]

【0877】 【化140】



[0878]

7ーヒドロキシー6, 6-ジメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-7, 8-ジヒドロー1H, 6H-4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー2ーオン (67mg, 0.18mmol) に室温で水素化リチウムアルミニウム(<math>1 Mテトラヒドロフラン溶液、 910μ L, 0.91 mmol)を加え、90 \mathbb{C} 0.5 時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(酢酸エチル)で精製し目的物を得た。(59%収率)

 $^{1}\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 1.13 (s, 3H),1.43 (s, 3H), 2.75–3.00 (m, 4H), 3.30–3.35 (m, 2 H), 3.50–3.70 (m, 2H),4.15–4.25 (m, 2H), 6.12 (s, 1H). 6.25 (s, 1H), 7.20–7.35 (m, 5H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 355 [M+1]^{+}$

 $MS (ESI^-) m / z: 389 [M+45]^+$

[0879]

6, $6-\overline{9}$ メチルー8-(2-7)エニルエチルアミノ)ー2, 3, 7, $8-\overline{9}$ トラヒドロー1 H, 6 Hー4, $5-\overline{9}$ オキサー $1-\overline{9}$ アザーアントラセンー $7-\overline{1}$ ール マレイン酸塩 6, $6-\overline{9}$ メチルー8-(2-7)エニルエチルアミノ)ー2, 3, 7, $8-\overline{9}$ トラヒドロー1 H, 6 Hー4, $5-\overline{9}$ オキサー $1-\overline{9}$ アザーアントラセンー $7-\overline{1}$ ール(36 mg, 0.10 m mol) の酢酸エチル溶液(800μ L)に室温でマレイン酸(14 mg, 0.12mmol)を加え、10分間攪拌した。ヘキサン(1 mL)を加え、0℃で30分間攪拌した。得られた結晶を濾取し、目的物を得た。(73%収率)

淡灰色結晶

mp: 160-162℃ (分解)

 $^{1}\text{H-NMR}$ (DMSO-d₆) δ : 1.04 (s, 3H),1.36 (s, 3H), 2.85-3.30 (m, 6H), 3.80-3.85 (m, 1H), 4.11 (d, J = 4.2 Hz, 2H),4.15-4.20 (m, 1H), 6.05 (s, 2H), 6.18 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).

[0880]

合成例 7 6

 $(3R^*, 4S^*)$ -4- $\{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]$ アミノ $\}$ -7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール

【0881】 【化141】

HONNAMA

[0882]

合成例18の方法を準拠して合成した。(収率42%)

白色結晶

mp.; 147-152℃

 $\begin{array}{l} \text{mp., 147-162} \\ ^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}); \ 1.26(\text{s}, 3\text{H}), \ 1.56(\text{s}, 3\text{H}), \ 2.59(\text{s}, 3\text{H}), \ 2.84-2.86(\text{m}, 2\text{H}), \ 2.92-3.09 \\ \text{(m, 2H), } \ 3.64(\text{d}, \ J=10.5\ \text{Hz}, 1\text{H}), \ 3.89(\text{d}, \ J=10.2\ \text{Hz}, 1\text{H}), \ 4.83(\text{s}, 2\text{H}), \ 6.99-7. \\ 05(\text{m}, 3\text{H}), \ 7.12-7.23(\text{m}, 2\text{H}), \ 7.29(\text{s}, 1\text{H}), \ 7.81(\text{s}, 1\text{H}) \end{array}$

MS(ESI+)m/z; 411 [M+1]+

MS(ESI-)m/z; 455 [M+45]+

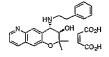
[0883]

合成例77

(3R*,4S*)-2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1-マレイン酸塩

[0884]

【化142】



[0885]

2,2-ジメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0886]

【化143】



[0887]

窒素雰囲気下、6-アミノ-2, 2-ジメチルクロメン(3.88g, 22.1 mmo1)、 三塩化ルテニウム(55.0 mg, 0.265 mmo1)のジエチレングリコールジメチルエーテル(8 mL)溶液に、室温で1, 3-プロパンジオール(0.639 mL, 8.84 mmo1)、トリn-ブチルホスフィン(0.132 mL, 0.530 mmo1)を加え、180 %で5時間攪拌した。反応終了後、フロリジールカラムでルテニウム錯体を除去し、溶媒を留去し、中圧カラムクロマトグラフィー(0.4 mmo1)で精製し、目的物(収率59%)を得た。

褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDCl}_{3})$; 1.49(s, 6H), 5.91(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.59(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.0 8(s, 1H), 7.24-7.28(m, 1H), 7.67(s, 1H), 7.93(d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.70(dd, J = 4.1 Hz, 1.7Hz, 1H)

MS(ESI+)m/z; 212 [M+1]+

[0888]

 $\overline{(3R^*,4R^*)}$ $\overline{-3,4}$ $\overline{-1}$ $\overline{-3,4}$ $\overline{-1}$ $\overline{-3,4}$ $\overline{-1}$ $\overline{-2H}$ \overline

[0889]

【化144】



[0890]

合成例12の方法に準拠して合成した。

[0891]

(収率65%)

CHIRALPAK AD-RH 20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40 保持時間 7.3分 褐色固体

 1 H-NMR(CDCl₃); 1.30(s, 3H), 1.65(s, 3H), 3.61(d, J= 4.4 Hz, 1H), 4.18(d, J= 4.4 Hz, 1H), 7.17(s, 1H), 7.34 (dd, J= 8.5 Hz, 4.4 Hz, 1H), 8.01(d, J= 7.7 Hz, 1H),

出証特2005-3008820

8.12(s, 1H), 8.79(dd, J= 4.1 Hz, 1.7Hz, 1H)MS(ESI+)m/z; 228 [M+1]+ [0892](3R*, 4S*) -2, 2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール [0893] 【化145】 [0894](収率58%) MS(ESI+)m/z; 349 [M+1]+ $MS(ESI_{-})m/z; 393 [M+45] +$ [0895](3R*,4S*)-2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1-マレイン酸塩 (収率79%) 白色結晶 mp.; 187-192℃(分解) $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6}); \ 1.16(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 1.50(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 2.94-3.00(\text{m}, \ 1\text{H}), 3.09-3.20(\text{m}, \ 2\text{H}), \ 3.000 + 1.000(\text{m}, \ 2\text{H}), \ 3.000(\text{m}, 34-3.37(m, 1H), 4.07-4.11(m, 1H), 4.69(d, J = 9.4Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.32(br s = 9.4Hz), 1H), 7.23-7.39 (m, 6H), 7.49 (dd, J=8.3Hz, 4.1 Hz, 1H), 8.22 (d, J=8.3 Hz, 1H) , 8.44(s, 1H), 8.80(d, J= 3.9 Hz, 1H)[0896][製剤例] 製剤例1 錠剤 10 g 本発明化合物 260g 糖 到. 600g微結晶セルロース 350gコーンスターチ ヒドロキシプロピルセルロース 100g CMC-Caステアリン酸マグネシウム 1, 500g 上記成分を常法により混合したのち1錠中に1mgの活性成分を含有する糖衣錠10, 000錠を製造する。 [0897]製剤例2 カプセル剤 10 g 本発明化合物 440 g 糖 1,000g 微結晶セルロース ステアリン酸マグネシウム 50g

全 量 1,500g 上記成分を常法により混合したのちゼラチンカプセルに充填し、1カプセル中に1 m g の活性成分を含有するカプセル剤 1 0,000カプセルを製造する。

[0898]

```
製剤例3
```

軟カプセル剤

本発明化合物 10g
PEG400 479g
飽和脂肪酸トリグリセライド 1,500g
ハッカ油 1g
ポリソルベート(Polysorbate)80 10g
全 量 2,000g

上記成分を混合したのち常法により3号軟ゼラチンカプセルに充填し、1カプセル中に1mgの活性成分を含有する軟カプセル剤10,000カプセルを製造する。

[0899]

製剤例4

軟膏

本発明化合物	1.0 g
流動パラフィン	10.0g
セタノール	20.0g
白色ワセリン	68.4g
エチルパラベン	0.1g
1ーメントール	0.5g
全 量	100.0g
	- 01

上記成分を常法により混合し、1%軟膏とする。

[0900]

製剤例 5

坐剤

本発明化合物 1 g ウィッテップゾールH15* 4 7 8 g ウィッテップゾールW35* 5 2 0 g ボリソルベート(Polysorbate)80 1 g 全 量 1,000 g

「* トリグリセライド系化合物の商標名

ウィッテップゾール=Witepsol」

上記成分を常法により溶融混合し、坐剤コンテナーに注ぎ冷却固化して1mgの活性成分を含有する1g坐剤1,000個を製造する。

[0901]

製剤例6

注射剤

本発明化合物注射用蒸留水

1 m g 5 m L

用時、溶解して用いる。

[0902]

「薬理試験例〕

有効不応期に及ぼす影響

試験方法

ビーグルイヌをペントバルビタールナトリウムにて麻酔し、人工呼吸管理下に正中開胸し心膜切開にて心臓を露出した。心電図測定は、右房自由壁、右心耳、右室自由壁の表面に双極電極を留置して行った。迷走神経刺激は、電気刺激装置を用いて、頸部両側迷走神経内に刺入留置したニクロム線を介して行った。迷走神経への電気刺激の条件は、心電図のRR間隔が刺激開始前より約100msec延長するように設定した。

心房および心室有効不応期は、両側迷走神経刺激下、300msecの基本刺激周期で、プログラム電気刺激装置を用いてS1-S2期外刺激法により測定した。心臓への電気刺激は、閾

値の2倍の電流を用い、基本刺激周期で10回の連続したS1刺激を与えた後、期外刺激S2を加えた。有効不応期測定のため、S1-S2間隔は2 msecずつ短縮していき、期外刺激S2の反応が消失した点を有効不応期とした。

評価は、薬物投与前に心房および心室有効不応期の測定を行い、その後各化合物は0.3mg/kgあるいは0.6mg/kgの用量で静脈内投与し、その5分後より心房および心室有効不応期の測定を行った。

結果は、心房および心室有効不応期の延長時間として、[薬物投与後の有効不応期]ー [薬物投与前の有効不応期] (msec)で表した。

[0903]

結果

[0904]

【表255】

		_			
実施例番号	投与量 (mg/kg)	心房不応期 (msec)	実施例番号	投与量 (mg/kg)	心房不応期 (msec)
2	0. 6	2 1	4 7	о. з	24
4	0 · 6	30	48	0.3	2 3
6	0.6	2 0	5 2	О. З	28
7	0.6	2 5	53	0.3	30
8	0.6	23	58	0.3	28
14	ი. ვ	2 7	59	0.3	2 2
18	о. З	2 7	60	0.3	2 2
19	о. з	2 6	6 1	О. З	2 0
23	о. з	2 2	63	0.3	2 3
24	0.3	23	6 9	0.3	37
2 5	0.3	2 7	7 1	О. З	31
26	0.3	24	73	0.3	31
27	0.3	32	74	0.6	2 5
41	0.3	31	7 7	0. 3	2 5

【産業上の利用可能性】

[0905]

本発明化合物は、心房に選択的な有効不応期延長作用を示すため、抗心房細動薬および 上室性不整脈治療薬として用いることができ、医薬品として有用である。また、本発明化 合物は、心室への影響が小さいことから、上記不整脈病態の安全な治療に貢献できる。 【書類名】要約書

【要約】

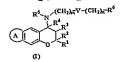
【課題】

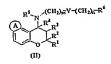
不整脈治療剤の提供。

【解決手段】

式 (I) 又は (II)

【化1】





〔式中、 R^1 及び R^2 は、それぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基又は C_{6-1} 4 アリール基を意味し、 R^3 は、水酸基若しくは C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基を意味するか、又は R^4 と一緒になって結合を意味し、 R^4 は水素原子を意味するか、又は R^3 と一緒になって結合を意味し、 R^4 は水素原子を意味するか、又は R^3 と一緒になって結合を意味し、 R^4 は水素原子を意味し、 R^5 は、水素原子又は R^5 は、水素原子又は R^6 は、水素原子、 R^6 は、水素原子、 R^5 は、水素原子又は R^5 は、水素原子又は R^5 は、水素原子又は R^5 は、水素原子又は R^5 は、水素原子又は R^5 は、水素原子、 R^6 は、水素原子、 R^6 は、水素原子、 R^5 は、水素原子、 R^5 は、水素原子又は R^5 は、水素原子のアルキル基、 R^5 は、水素原子のアルキル基、 R^5 は、水素原子のアルキル基、 R^5 は、水素原子のアルキル基、 R^5 は、水素原子のアルキル基を意味し、 R^5 は、水素原子のアルキルを意味し、 R^5 は、水素原子のアリールを意味し、 R^5 は、 R^5 は、 R^5 は、水素原子のアルキルを意味し、 R^5 は、
【選択図】 なし

特願2004-084605

出願人履歷情報

識別番号

[000003986]

1. 変更年月日 [変更理由] 1990年 8月29日

新規登録

住 所 氏 名 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

日産化学工業株式会社